

Rec'd PCT/PTO 24 MAY 2005

PCT/EP03/14469

Ministero delle Attività Produttive

Direzione Generale per lo Sviluppo Produttivo e la Competitività

Officio Italiano Brevetti e Marghi

Ufficio G2

REC'D 0 6 FEB 2004

Autenticazione di copia di documenti relativi alla domanda di brevetto per:

N. MI2002 A 002758

Invenzione Industriale

Si dichiara che l'unita copia è conforme ai documenti originali

deposităti con la domanua urbievetto sopțaspecincată, i cui dati

risultano dall'accluso processo verbale di deposito.

103

PRIORITY DOCUMENT

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN COMPLIANCE WITH RULE 17 1(a) OR (b)

ILDIRIGENTE

D.ssa Paola DI CINTIO



BEST AVAILABLE COPY

A HORIZONIA PERIODIC SAGNO RICERCA S.R.L. 10 Temperaturation SAGNO RICERCA S.R.L. 20 Temperaturation MILANO code code	UFFICIO ITALIAN	DELLE ATTIVITÀ PRODUTTIVE DISTRIBUTI E MARCHI - ROMA ETTO PER INVENZIONE INDUSTRIALE, DEPOSITO RISERVE, A	ANTICIPATA ACCESSIBILITÀ AL PU	MODULO
SAGOLDANIA DE CERTO RECENTA AN CONTROL SACOLDANIA DE CONTROL D	A. RIGHIEDENTE (I)			10.33; Epro
Notificition Noti	• •	I ISAGRO RICERCA S R.I.		5
2) DESCRIPTION SECRETARY DEL SERVESTRY PRESSO (*LLEAR. COGNORNO RIME **CONTROL DEL CRESCORT. ANDONO 1.5 ALTER CONTROL DEL CRESCORT. ANDONO 1.5 ALTER **CONTROL DEL CRESCORT. ANDONO 1.5 ALTER **CONTROL DEL CRESCORT. AND ATTIVITA" ERBICIDA **ITORIA ACCIDENTA A FORBANCO S. L. DOLL CRESCORT. AND ATTIVITA" ERBICIDA **ITORIA ACCIDENTA A FORBANCO S. L. DOLL CRESCORT. AND ATTIVITA ERBICIDA **ITORIA ACCIDENTA A FORBANCO S. L. DOLL CRESCORT. AND ATTIVITA ERBICIDA **ITORIA ACCIDENTA A FORBANCO S. L. DOLL CRESCORT. AND ATTIVITA ERBICIDA **ITORIA ACCIDENTA A FORBANCO S. L. DOLL CRESCORT. AND ATTIVITA ERBICIDA **ITORIA ACCIDENTA A FORBANCO S. L. DOLL CRESCORT. AND ATTIVITA ERBICIDA **ITORIA ACCIDENTA A FORBANCO S. L. DOLL CRESCORT. AND ATTIVITA ERBICIDA **ITORIA ACCIDENTA A FORBANCO S. L. DOLL CRESCORT. AND ATTIVITA ERBICIDA **ITORIA ACCIDENTA A FORBANCO S. L. DOLL CRESCORT. AND ATTIVITA ERBICIDA **ITORIA ACCIDENTA A FORBANCO S. L. DOLL CRESCORT. AND ATTIVITA ERBICIDA **ITORIA ACCIDENTA A FORBANCO S. L. DOLL CRESCORT. AND ATTIVITA ERBICIDA **INTORIA DEL CRESCORT. AND ATTIVITA ERBICITA ENCORTE EN	•			OVECT
B. REPERSENTANTE DEL BIBRICHETE FRESSO L'ULB.B. S. REPERSENTANTE DEL BIBRICHETE FRESSO L'ULB.B. OCCUPION DEL CIPE CORPECCION. DEL CIPE CORP. TANK CONCILLA C. ALLES CONCINCION. OCCUPION DEL CIPE CORP. TANK CONCILLA CONCILLA C. ALLES CONCILLA CO	Residenza	MILANO	codi	
IL RIPPERSENTANTE BEL RICHERTET PRESSE L'ULAIN. CORPIONE NONE DE DEGREGORI - ARTONOLIS - O-ALESS VIE L'ADRIGONUOVO IN LULI JORNIE MILANO S.P.A. VIE L'ADRIGONUOVO IN L'ADRIGONUO AND L'ADRI	Denominazione	L		Waren, Waren
CONTRIBUTION OF THE PROTOCOLLA CANAGEMENT AND CONTRIBUTION OF THE CONT	Residenza	<u> </u>	codi	CO LILI
CONTRIBUTION OF THE PROTOCOLLA CANAGEMENT AND CONTRIBUTION OF THE CONT	D DADDDECENTANTE	IEI BIPUIENENTE BRECCO L'II I D M		
SECURIOR ALUGATA CONTINUE ALUGATA CONTINUE BI MICRORGANSEM, denominators Link Li	1		,	
VIOLED CONTROL CULTURO destinatorio VIOLED CONTROLLO CULTURO destinatorio VIOLED CONTROLLO CULTURO destinatorio VIOLED CONTROLLO CULTURO destinatorio NUOVI URACILII AD ATTIVITA ERBICIDA ANTICIPATA ADCESSIBILITÀ AL PUBBLICO: SI NO VIOLED CONTROLLO CON	-		•	ale Lilii .
BORDIGUED ELITTIUS destinatorio NETTELO ANTICOVET URACITATA ATTIVITA* ERBICIDA ANTICOVET URACITATO DI RACCOLTA COUTINE DI MICENDAMISSINI, denominazione 1) LEGAZIA GIOVANNI 2) PARRAVIDINO PIERO 5. PRIGITATA BIRGINI BIR	denominazione studi	di appartenenza LNG. BARZANO' & ZANARDO	MILANO S.p.A.	
NUOVI URACILIT AD ATTIVITA ERBICIDA AITICIPATA ACCESSIBILITÀ AL PERBLUDO: IN UNIONI URACILIT AD ATTIVITA ERBICIDA AITICIPATA ACCESSIBILITÀ AL PERBLUDO: IN UNIONI URACILIT AD ATTIVITA ERBICIDA AITICIPATA ACCESSIBILITÀ AL PERBLUDO: IN DESTRUTA COURT CONTINUE COMPINIO COMPINIO COMPINIO COMPINIO CONTINUE AND CONTI	via LBORGON	JOVO n. LLL_L_lOcii	tà L MILANO	cap 210121 (prov) LNT 1
DUDOVI URACTILI AD ATTIVITA' ERBICIDA ATTIDIPATA ADCESSIBILITÀ AL PUBBLICO: OPERATORIO CONTROLLO CONTROL	C. DOMICILIO ELETTIV	destinatario		
DUDOVI URACTILI AD ATTIVITA' ERBICIDA ATTIDIPATA ADCESSIBILITÀ AL PUBBLICO: OPERATORIO CONTROLLO CONTROL	via I	lalite	+3 l	mal
ANTICHYTA ACCESSMENTA ACCESSME				cap Clarific (prov) Clarific
AMINISTRA RECESSABLITÀ AL PUBBLICIO: INVERTIZE RECESSABLITÀ AL PUBBLICIO: INVERTIZE RECESSABLITÀ AL PUBBLICIO: INVERTIZE SE CISTATA COLON COOPER DE CONTRO TORRE DE CONTRO	u. IIIULU	classe proposta (sez/cl/sci)	uppo/sottogruppo LILI/LILI	
MEAZZA GIOVANNI 3) BETTARINI FRANCO	NUOVI URA			
MEAZZA GIOVANNI 3) BETTARINI FRANCO		LITÀ AL PUBBLICO: SI 🗌 NO 🜙	SE ISTANZA: DATA	N° PROTOCOLLO L
F. PRIORITÀ Razione o organizzazione Ilpo di priorità numero di domanda data di depositio S,R 1) 2) G. CERTRO ABILITATO III RACCOLTA COLTUBE DI MICEORGANISMI, denominazione H. ARNOTAZIONI SPECIALI BEGUIRENTAZIONI SPECIALI BEGUIRENTAZIONI SPECIALI BEGUIRENTAZIONI SPECIALI BEGUIRENTAZIONI SPECIALI BEGUIRENTAZIONI A paga L.9.65 riassanto con disegno principale, descrizione e riventicazioni (obbligatorio 1 seemplane) Doc. 2) L. DEGO: Doc. 3) L. DEGO: Doc. 4) L. DEGO: Doc. 4) L. DEGO: Doc. 5) Doc. 6) Doc. 5) Doc. 6) BED: Doc. 100-11 RED: Doc. 100-12 RED: Doc. 100-13 Doc. 100-14 Doc. 100-15 Doc. 1		A ATATABATT		
F. PRIORITÀ nazione e organizzazione tipo di priorità numero di domanda data di deposito SR n' Protocolio 1) 2) 6. CENTRO ABILITATO DI RACCOLIVA COLITURE DI MICRORGANISMI, denominazione H. ANHOTAZIONI SPECIALI BEGUIERITAZIONE ALLEGATA N. Os. Doc. 1) 1.2 TREO n. psg. SL6 riassunto con disegno principale, descrizione e rivendizazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) 1.1 TREO n. tav. L. disegno (obbligatorio se citato in descrizione e rivendizazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 3) 1.1 TREO designazione investore designazione investore Doc. 5) 1.1 TREO documenti di priorità con Iraduzione in italiano Doc. 6) 1.1 TREO documenti di priorità con Iraduzione in italiano Doc. 6) 1.2 TREO documenti di priorità con Iraduzione in italiano Doc. 6) 1.3 TREO documenti di priorità con Iraduzione in italiano Doc. 6) 1.4 TREO documenti di priorità con Iraduzione in italiano Doc. 6) 1.5 TREO documenti di priorità con Iraduzione in italiano Doc. 7) 1.5 TREO DOCUMENTO IN CARLE AGR. DI LINIANO DI PRESENTE ATTO SI RIGHIEDE COPIA AUTENTICA SI/NO DEL PRESENTE ATTO SI RIGHIEDE COPIA AUTENTICA SI/NO DEL PRESENTE ATTO SI RIGHIEDE COPIA AUTENTICA SI/NO L'Allegato DI DEPOSITO NUMERO DI DOMANDA MIZODZA DOCESTO NUMERO DI DOCUMENTO DI DOCUMEN	,			,
Tazione o organizzazione Itipo di priorità numero di domanda data di deposito M'Priocollo L'/ / / /	2) PARAV	IDINO PIERO 4)	FORNARA LUCA	
nazione o organizzazione tipo di priorità numero di domanda data di deposito SR Data N° Protocollo 1	F. PRIORITÀ		•	SCIOGLIMENTO RISERVE
2) C. CENTRO ABILITATO DI RACCOLTA COLTÜBE DI MICEORGANISMI, denominazione H. ANNOTAZIONI SPECIALI BEGUNERITAZIONE ALLEGATA N. C. Doc. 1) L. 2 FEBEZ n. pag. 9.6 riassunto con disegno principale, descriziona e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L. RES Doc. 1) L. RES designazione inventore Doc. 3) L. RES designazione inventore Doc. 5) L. RES designazione inventore Doc. 6) L. RES designazione inventore Doc. 7) L. 2 CONTINUA RILLEGATA N. C. RES Doc. 10 L. RES D	nazione o orga	ulzzazione tipo di priorità numero di domanda		
CENTRO ABILITATO DI RACCOLTA COLTÜRE DI MICRORGANISMI, denominazione H. ARROTAZIONI SPECIALI DOCUMENTAZIONE ALLEGATA N. es. Doc. 1) L2 [FBIX2] n. pog. [9.6] diassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (dobligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L1 [FBIX2] n. tov. L1 disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 3) L1 [FBIX3] n. tov. L1 disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 4) L1 [FBIX3] designazione inventore Doc. 5) L1 [FBIX3] decumenti di priorità con tradizione in Italiano Doc. 6) L1 [FBIX3] documenti di priorità con tradizione in Italiano Doc. 7) L1 sulla di versamento. Italia Euro Doc. 8) L1 [FBIX3] decumenti di priorità con tradizione in Italiano Doc. 9) L2 [FBIX3] decumenti di priorità con tradizione in Italiano Doc. 10 [FBIX3] decumenti di priorità con tradizione in Italiano Doc. 10 [FBIX3] decumenti di priorità con tradizione in Italiano Doc. 10 [FBIX3] decumenti di priorità con tradizione in Italiano Doc. 10 [FBIX3] decumenti di priorità la priorità contradizione del priorità la priorità	,			1 121 111 111
G. CENTRÓ ABILITATO DI RACCOLTÀ COLTÜRE DI MICRORGANISMI, denominazione H. AMNOTAZIONI SPECIALI BEGUMENTAZIONE ALLEGATA N. cs. Doc. 1) L2 (ERIOY n. pag. 4.9.6) riassunto con disegno principals, descrizione e riverdicazioni (obbligatorio 1 esemplare)	1) 1		ا ليسا/ليا/ليا ا	
H. AMNOTAZIONI SPECIALI BUCURENTAZIONE ALLEGATA SOGGLIMENTO RISERVE Data N° Protocolo L2 RREV n. pag. Q.6 disasunto con disagno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) L1/L1/L1/L1/L1/L1/L1/L1/L1/L1/L1/L1/L1/L	· 2)		لا ليينا/ليا/ليا ل	التبيياالياالياليا
DOC. 1) L2 FROV n. pag. L9.65 riassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L FROV n. pag. L9.65 riassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L FROV n. tav. L. disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 3) L FROV n. tav. L. disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 4) L3 FROV designazione inventore Doc. 5) L FROV designazione inventore Doc. 5) L FROV designazione inventore Doc. 6) L FROV designazione inventore Doc. 7) L nonincativo completo del richiedente Si attestati di versamento. totale Euro DUATTROCENTOSETTANTADUE/56 COMPILATO IL L2/8-11/2-12-01/0 2 FIRMA DEL(I) RICHIEDENTE(I) L MANDATARI (Firma per sò o per gli altri CONTRIBUA SI/ND L NO DEL PRESENTE ATTO SI RICHIEDE COPIA AUTENTICA SI/ND L S I CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE ARINOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE CONTRIBUTATIONE	G. CENTRO ABILITATI	DI RACCOLTA COLTURE DI MICRORGANISMI, denominazione	·	
DOC. 1) L2 FROV n. pag. L9.65 riassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L FROV n. pag. L9.65 riassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L FROV n. tav. L. disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 3) L FROV n. tav. L. disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 4) L3 FROV designazione inventore Doc. 5) L FROV designazione inventore Doc. 5) L FROV designazione inventore Doc. 6) L FROV designazione inventore Doc. 7) L nonincativo completo del richiedente Si attestati di versamento. totale Euro DUATTROCENTOSETTANTADUE/56 COMPILATO IL L2/8-11/2-12-01/0 2 FIRMA DEL(I) RICHIEDENTE(I) L MANDATARI (Firma per sò o per gli altri CONTRIBUA SI/ND L NO DEL PRESENTE ATTO SI RICHIEDE COPIA AUTENTICA SI/ND L S I CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE ARINOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE CONTRIBUTATIONE	L			1
DOC. 1) L2 FROV n. pag. L9.65 riassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L FROV n. pag. L9.65 riassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L FROV n. tav. L. disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 3) L FROV n. tav. L. disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 4) L3 FROV designazione inventore Doc. 5) L FROV designazione inventore Doc. 5) L FROV designazione inventore Doc. 6) L FROV designazione inventore Doc. 7) L nonincativo completo del richiedente Si attestati di versamento. totale Euro DUATTROCENTOSETTANTADUE/56 COMPILATO IL L2/8-11/2-12-01/0 2 FIRMA DEL(I) RICHIEDENTE(I) L MANDATARI (Firma per sò o per gli altri CONTRIBUA SI/ND L NO DEL PRESENTE ATTO SI RICHIEDE COPIA AUTENTICA SI/ND L S I CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CAMIERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE CONTRIBUTATIONE ARINOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE CONTRIBUTATIONE	H ANNUTAZIONI SPE	101)		
N. es. Doc. 1) L2 PROV n. pag. 9.6 rlassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L PROV n. tav. L disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 3) L1 RES teltera d'incarico, procura o riferimento procura generale LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/L	1	1712		
N. es. Doc. 1) L2 PROV n. pag. 9.6 rlassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L PROV n. tav. L disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 3) L1 RES teltera d'incarico, procura o riferimento procura generale LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/L				
N. es. Doc. 1) L2 PROV n. pag. 9.6 rlassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L PROV n. tav. L disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 3) L1 RES teltera d'incarico, procura o riferimento procura generale LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/L				
N. es. Doc. 1) L2 PROV n. pag. 9.6 rlassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L PROV n. tav. L disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 3) L1 RES teltera d'incarico, procura o riferimento procura generale LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/L	L			
N. es. Doc. 1) L2 PROV n. pag. 9.6 rlassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare) Doc. 2) L PROV n. tav. L disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 3) L1 RES teltera d'incarico, procura o riferimento procura generale LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/LJ/L				· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
Doc. 1) L2 FROV n. pag. Q.6 riassunto con disegno principale, descrizione e rivendicazioni (obbligatorio 1 esemplare)		EGATA		SCIOGLIMENTO RISERVE
Doc. 2) L FROV n. tav. L disegmo (obbligatorio se citato in descrizione, 1 esemplare) Doc. 3) L1 RRS lettera d'incarico, procura o rilerimento procura generale Doc. 4) L1 RRS designazione inventore		vii lat i i i i i i i i i i i i i i i i i i i		1
Doc. 3) 1 RIS lettera d'incarico, procura o rilerimento procura generale			ndicazioni (obbligatorio 1 esemplare)	///
Doc. 4) L1 RS designazione inventore	Doc. 2) PRO	🕖 n. tav. 📖 disegno (obbligatorio se citato in descrizione, 1 es	emplare)	
Doc. 4) L3 RBS designazione inventore	Doc. 3) L1 Ri	lettera d'incarico, procura o rilerimento procura ge	nerale	الصياباالباالياا
Doc. 5) L RE documenti di priorità con traduzione in italiano				
DOC. 6) RIS autorizzazione o atto di cessione		- designations missing		
Doc. 7) nominativo completo del richiedente 8) attestati di versamento. totale Euro OUATTROCENTOSETTANTADUE/56 obbligatorio COMPILATO IL 2 8 1 2 2 0 0 2 FIRMA DEL(I) RICHIEDENTE(I) I MANDATARI (firma per sò e per gli altri CONTINUA SI/NO NO DEL PRESENTE ATTO SI RICHIEDE COPIA AUTENTICA SI/NO I MILANO Codice 1.5 VERBALE DI DEPOSITO NUMERO DI DOMANDA MIZODZA OO2758 Reg. A L'anno DUEMILADUE Il giorro VENTITRE del mese di DICEMBRE Il (i) richiedente(i) sopraindicato(i) ha(hanno) presentato a me sottoscritto la presente demanda, correduta in . QQ fogli aggiuntivi per la concessione del brevetto soprariportato. I. ANNOTAZIONI VARIE DELL'UFRICIALE ROGANTE SI	· · · · · ·	-		confronta singole priorità
8) altestati di versamento. totale Euro QUATTROCENTOSETTANTADUE/56 COMPILATO IL 2811/212002 FIRMA DEL(I) RICHIEDENTE(I) I MANDATARI (firma per sò e per gli altri CONTINUA SI/NO NO DEL PRESENTE ATTO SI RICHIEDE COPIA AUTENTICA SI/NO SI CAMERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO VERBALE DI DEPOSITO NUMERO DI DOMANDA MIZOOZA OO2758 Reg. A L'anno DUEMILADUE I QUITIR VENTITRE , del mese di DICEMBRE II(i) richiedente(i) sopraindicato(i) ha(hanno) presentato a me sottoscritto la presente domanda, correttato in . L. ANNOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE	· · · · · ·	documenti di priorità con traduzione in italiano	***************************************	1
8) altestati di versamento. totale Euro QUATTROCENTOSETTANTADUE/56 COMPILATO IL 2811/212002 FIRMA DEL(I) RICHIEDENTE(I) I MANDATARI (firma per sò e per gli altri CONTINUA SI/NO NO DEL PRESENTE ATTO SI RICHIEDE COPIA AUTENTICA SI/NO SI CAMERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO VERBALE DI DEPOSITO NUMERO DI DOMANDA MIZOOZA OO2758 Reg. A L'anno DUEMILADUE I QUITIR VENTITRE , del mese di DICEMBRE II(i) richiedente(i) sopraindicato(i) ha(hanno) presentato a me sottoscritto la presente domanda, correttato in . L. ANNOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE	Doc. 5)	- Cooding in a provide con tradectorio si figuratio	•	الماليا/ليا/ليماليما
COMPILATO IL 28 12 200 2 FIRMA DEL(I) RICHIEDENTE(I) I MANDATARI (firma per sò e per gli altri continua si/no NO DEL PRESENTE ATTO SI RICHIEDE COPIA AUTENTICA SI/NO VERBALE DI DEPOSITO NUMERO DI DOMANDA MIZOOZA OOZ758 Reg. A L'anno DUEMILADUE IL QIQUP VENTITRE J., del mese di DICEMBRE II(i) richiedente(i) sopraindicato(i) ha(hanno) presentato a me sottoscritto la presente domanda, correitato i n. I. ANNOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE	Doc. 5)	autorizzazione o atto di cessione	•	لبالبا/لبا/لبالبيا
CONTINUA SI/NO NO DEL PRESENTE ATTO SI RICHIEDE COPIA AUTENTICA SI/NO MILANO COdice (1.5) VERBALE DI DEPOSITO NUMERO DI DOMANDA MIZOOZA OOZ758 Reg. A. L'anno DUEMILADUE Reg. A. L'anno DUEMILADUE Reg. A. L'injerpe VENTITRE del mese di DICEMBRE Il (i) richiedente(i) sopraindicato(i) ha(hanno) presentato a me sottoscritto la presente domanda, correttate in QQ fogli aggiuntivi per la concessione del brevetto soprariportato. I. ANNOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE	Doc. 5)	autorizzazione o atto di cessione		
CAMERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO VERBALE DI DEPOSITO NUMERO DI DOMANDA MIZODZA OO2758 L'anno DUEMILADUE II Giorno VENTITRE II GIORNO VENTITRE	Doc. 5)	autorizzazione o atto di cessione nominativo completo del richiedente o. totale Euro OUATTROCENTOSETTANTADUE/	56	obbligatorio
CAMERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO CODICE 15 VERBALE DI DEPOSITO NUMERO DI DOMANDA MIZOOZA OO2758 Reg. A. L'anno DUEMILADUE II giorre VENTITRE del mese di DICEMBRE II(i) richiedente(i) sopraindicato(i) ha(hanno) presentato a me sottoscritto la presente domanda, correlate in n. 199 fogli aggiuntivi per la concessione del brevetto soprariportato.	Doc. 5) L RI Doc. 6) L RI Doc. 7) L 8) allestati di versamen COMPILATO IL L	autorizzazione o atto di cessione nominativo completo del richiedente o. totale Euro OUATTROCENTOSETTANTADUE/	56	obbligatorio
CAMERA DI COMMERCIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO COdice 15 VERBALE DI DEPOSITO NUMERO DI DOMANDA MIZOOZA 002758 Reg. A. L'anno DUEMILADUE II giorpo VENTITRE , del mese di DICEMBRE II(i) richiedente(i) sopraindicato(i) ha(hanno) presentato a me sottoscritto la presente domanda, correlate in QQ fogli aggiuntivi per la concessione del brevetto soprariportato. I. ANNOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE	Doc. 5) L RI Doc. 6) L RI Doc. 7) L 8) allestati di versamen COMPILATO IL L	autorizzazione o atto di cessione	56	obbligatorio
VERBALE DI DEPOSITO NUMERO DI DOMANDA MIZOOZA 002758 Reg. A. L'anno DUEMILADUE VENTITE , del mese di DICEMBRE II (i) richiedente(i) sopraindicato(i) ha(hanno) presentato a me sottoscritto la presente domanda, correttate in n. IQQ fogli aggiuntivi per la concessione del brevetto soprariportato. I. ANNOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE	Doc. 5) RI Doc. 6) RI Doc. 7) LI 8) allestati di versamen COMPILATO IL LC CONTINUA SI/NO L	autorizzazione o atto di cessione	56	obbligatorio
VERBALE DI DEPOSITO NUMERO DI DOMANDA MIZOOZA 002758 Reg. A. L'anno DUEMILADUE VENTITE , del mese di DICEMBRE II (i) richiedente(i) sopraindicato(i) ha(hanno) presentato a me sottoscritto la presente domanda, correttate in n. IQQ fogli aggiuntivi per la concessione del brevetto soprariportato. I. ANNOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE	Doc. 5)	autorizzazione o atto di cessione	56	obbligatorio
L'anno DUEMILADUE Il giorge VENTITRE Il giorge Ventitale vin .	Doc. 5) RI Doc. 6) RI Doc. 7) Society of the second of	autorizzazione o atto di cessione nominativo completo del richiedente o. totale Euro QUATTROCENTOSETTANTADUE/ BL11/2-2-0-0 2 FIRMA DEL(I) RICHIEDENTE(I) L NO SI RICHIEDE COPIA AUTENTICA SI/NO L J J	56	obbligatorio la per sè e per gli altri)
II(i) richiedente(i) sopraindicato(i) ha(hanno) presentato a me sottoscritto la presente domanda, correttate ii n. LANNOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE	Doc. 5) RI Doc. 6) RI Doc. 7) Society of the second of	autorizzazione o atto di cessione nominativo completo del richiedente o. totale Euro QUATTROCENTOSETTANTADUE/ EL BL 11/2 2 0 0 2 FIRMA DEL(I) RICHIEDENTE(I) L NO SI RICHIEDE COPIA AUTENTICA SI/NO L SI I SI I SI I SI IIII MILANO MILANO	56	obbligatorio la per sè e per gli altri)
II(i) richiedente(i) sopraindicato(i) ha(hanno) presentato a me sottoscritto la presente domanda, correttate ii n. LANNOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE	Doc. 5)	autorizzazione o atto di cessione nominativo completo del richiedente o. totale Euro QUATTROCENTOSETTANTADUE/ EL BL 11/2 2 0 0 2 FIRMA DEL(I) RICHIEDENTE(I) L NO SI RICHIEDE COPIA AUTENTICA SI/NO L SI I SI I SI I SI IIII MILANO MILANO	56 I MANDATARI (firm	obbligatorio la per sè e per gli altri)
I. ANNOTAZIONI VARIE DELL'UFFICIALE ROGANTE	Doc. 5) RI Doc. 6) RI Doc. 7) Solution of the complete of t	autorizzazione o atto di cessione nominativo completo del richiedente o. totale Euro QUATTROCENTOSETTANTADUE/ S 1 2 2 0 2 FIRMA DEL(I) RICHIEDENTE(I) NO RICHIEDE COPIA AUTENTICA SI/NO S I EIO IND. ART. E AGR. DI MILANO MILANO NUMERO DI DOMANDA MIZOOZA OO2758	56 I MANDATARI (firm	obbligatorio codice 15
	Doc. 5) RI Doc. 6) RI Doc. 7) Solition of the compilator of the co	autorizzazione o atto di cessione	56 I MANDATARI (firm	codice 1.5
	Doc. 5)	autorizzazione o atto di cessione	56 I MANDATARI (firm	codice 1.5
	Doc. 5)	autorizzazione o atto di cessione	56 I MANDATARI (firm	codice 1.5
II BETROCTANTE	Doc. 5) RI Doc. 6) RI Doc. 7) Society of the second of the	autorizzazione o atto di cessione	56 I MANDATARI (firm I Reg. A ENTITE Lida un. QQ fogli aggluntivi po	codice 1.5
IL DEPOSITANTE ANY COLOR STATE	Doc. 5) RI Doc. 6) RI Doc. 7) Society of the second compilator it RE CONTINUA SI/NO LE DEL PRESENTE ATTO CAMERA DI COMMERI VERBALE DI DEPOSITO L'anno LI II(i) richiedente(i) sopra I. ANNOTAZIONI VARI L	autorizzazione o atto di cessione	56 I MANDATARI (firm I Reg. A ENTITE Lida un. QQ fogli aggluntivi po	codice 1.5

	PRUSPETTU A
RIASSUNTO INVENZIONE CON DISEGNO PALE, DESCRIZIONE E RIVENDICAZIONE MIZOOZA 00	PATA DI DEPOSITO 23/112/12002
NUMERO DOMANDA REG. A	DAIN DI DEI COITO
NUMERO BREVETTO	DATA DI RILASCIO
D. TITOLO	
"Nuovi uracili ad attività erbicida".	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
L RIASSUNTO	and the companies when the companies are assumed the companies of the comp
Sono descritti nuovi uracili aventi formu	ıla generale (I):
. R	
X ₁	
	ESTERO DO
× ö	
^3	THE TAX TO
	and a distribution of the state
(I)	10,33 EUEO
e il loro uso quali erbicidi.	•
M. DISEGNO	

M. DISEGNO	•					
<u> </u>	 · · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		 	 	 	
				•		
		•			-	

.

DESCRIZIONE dell'invenzione industriale

a nome: ISAGRO RICERCA S.r.l.

di nazionalità: Italiana

con sede in: Milano - Italia.

MI 2002A 0 0 2 7 5 8.

La presente invenzione riguarda nuovi uracili.

Più in particolare, la presente invenzione riguarda nuovi uracili aventi elevata attività erbicida, procedimenti per la loro preparazione ed il loro impiego come erbicidi per il controllo di erbe infestanti in colture agricole.

Uracili ad attività erbicida sono descritti, tra gli altri, nei brevetti o domande di brevetto US 4859229, US 5084084, EP 1122244 e WO 01/77084.

La Richiedente ha ora sorprendentemente trovato uracili che, rispetto ai prodotti descritti nei brevetti brevetto sopra citate, presentano domande di caratteristiche migliorate in termini di erbicida nei confronti delle erbe infestanti e/o in termini di minore fitotossicità per le colture di interesse agrario.

Costituiscono pertanto oggetto della presente invenzione nuovi uracili aventi formula generale (I):



$$X_1$$
 X_2
 X_3
 X_4

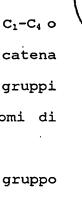
(I)

in cui:

- X_1 rappresenta un atomo di idrogeno od un atomo di alogeno;
- X2 rappresenta un atomo di alogeno;
- X₄ rappresenta un gruppo aloalchilico C₁-C₃;
- R rappresenta un atomo di idrogeno, un gruppo alchilico C₁-C₃ od un gruppo aloalchilico C₁-C₃;
- G rappresenta un atomo di ossigeno od un atomo di zolfo;
- X_3 rappresenta un gruppo $Q(CR_1R_2)_nZ$ -, un gruppo Q_1Z , un gruppo Q2-, un gruppo Y(OC)-CR6=CR5-CR3R4Z-;
- Z rappresenta un atomo di ossigeno od un atomo di zolfo;
- $-R_1$ R₃ e R₄, uguali o diversi tra R₂, rappresentano un atomo di idrogeno, un gruppo alchilico C₁-C₄ od un gruppo aloalchilico C₁-C₄;
- R₅ rappresenta un gruppo OR₁;

- rappresenta un atomo di idrogeno od un gruppo alchilico C1-C4;
- R_1 rappresenta un gruppo alchilico C_1 - C_4 o un gruppo aloalchilico C1-C4;
- Y rappresenta un gruppo OR8, un gruppo SR9, un gruppo $NR_{10}R_{11};$
- R₈ e R₉ rappresentano un atomo di idrogeno, un gruppo alchilico C₁-C₆ lineare o ramificato, un gruppo aloalchilico C₁-C₆ lineare o ramificato, cicloalchilico C3-C6, un gruppo cicloalchilalchilico C4-C, un gruppo cianoalchilico C₃-C₆, un alcossialchilico C3-C6, un gruppo ossetanilico, un gruppo tetraidrofuranilico; un gruppo fenilico, un gruppo fenilalchilico C7-C12 o un gruppo piridilico, detti gruppi a loro volta eventualmente sostituiti con uno o più atomi di alogeno scelti tra cloro, fluoro, bromo o iodio, oppure sostituiti con uno o più gruppi scelti tra alchile C_1-C_4 o aloalchile C_1-C_4 , alcossi C_1-C_4 o aloalcossi C₁-C₄;
- R₁₀ e R₁₁, uguali o diversi tra loro, rappresentano un atomo di idrogeno, oppure un gruppo alchilico C_1-C_6 , un gruppo aloalchilico C1-C6, un gruppo cicloalchilico C3-C6; un gruppo arilalchilico C7-C12 oppure un gruppo arilico, detti gruppi a loro volta eventualmente sostituiti con uno o più atomi di alogeno scelti tra cloro, fluoro,

bromo o iodio, oppure sostituiti con uno o più gruppi scelti tra alchile C₁-C₄ o aloalchile C₁-C₄, alcossi C₁-C₄ o aloalcossi C₁-C₄; oppure insieme rappresentano una catena alchilenica C2-C7 eventualmente sostituita da gruppi alchilici C1-C4 ed eventualmente interrotta da atomi di ossigeno o da un gruppo NR12 in cui:



- R_{12} rappresenta un atomo di idrogeno, un gruppo alchilico C₁-C₆ o aloalchilico C₁-C₆, un gruppo alchenilico C_3-C_6 o aloalchenilico C_3-C_6 , un gruppo alchinilico C₃-C₆ o aloalchinilico C₃-C₆, un gruppo alcossialchilico C2-C8 o aloalcossialchilico C2-C8, un gruppo alchilcarbonilico C2-C7 o aloalchilcarbonilico C2-C7;
- n rappresenta 1, 2 oppure 3;
- Q rappresenta un gruppo eterociclico scelto pirrol-2-il, pirrol-3-il, imidazol-2-il, imidazol-4-il, imidazol-5-il, pirazol-3-il, pirazol-4-il, pirazol-5-il, 1,2,4-triazol-3-il, 1,2,4-triazol-5-il, 1,2,4-triazol-3onil, 1,2,3-triazolil, tetrazolil, ossazolil, isossazol-5-il, tiazol-2-il, tiazol-5-il, isotiazolil, ossadiazolil, 1,3,4-tiadiazolil, 1,2,4-tiadiazolil, 1,2,4-ossadiazolil, 1, 2, 4-ossadiazol-5-on-3-il, benzossazol-2-il, benzotiazol-2-il, pirazinil, piridazinil, 1,2,4-triazinil, detti gruppi a loro volta eventualmente sostituiti con atomi di alogeno scelti tra

cloro, fluoro, bromo o iodio, oppure sostituiti con gruppi scelti tra alchile C1-C6 o aloalchile C1-C6, alchenile C2-C6 o aloalchenile C2-C6, alchenilossi C2-C6 o aloalchenilossi C2-C6, alchinile C2-C6 o aloalchinile C2- C_6 , alchinilossi C_2 - C_6 o aloalchinilossi C_2 - C_6 , alcossi C_1 aloalcossi C₁-C₆, alcossialchile aloalcossialchile C_2 - C_6 , alchiltio C_1 - C_6 o aloalchiltio C_1 alchilsolfinico C₁-C₆ o alolchilsolfinico alchilsolfonico C₁-C₆ o alolchilsolfonico C_1-C_6 alcossicarbonile C_2-C_6 o aloalcossicarbonile C_2-C_{6L} alcossicarbonilalchile C_3-C_8 o aloalcossicarbonilalchile C_3-C_0 , alcossicarbonilalcossi C_3-C_0 , amminocarbonilalcossi C₃-C₈ eventualmente sostituito con gruppi alchilici C₁-C₄ oppure con un alchilene C₂-C₅; CN, CHO, NO₂, cianoalchile C_1-C_3 , cianoalchilossi C_1-C_3 aloalchilcarbonile alchilcarbonile C_2-C_6 C_2-C_6 alcossimminoalchile C2-C6, aloalcossimminoalchile C2-C6, amminocarbonilalchile amminocarbonile, C_2-C_6 amminosolfonile o amminosolfonilalchile C2-C6, questi ultimi quattro gruppi eventualmente sostituiti con uno o due gruppi alchilici C1-C4 oppure con un alchilene C2-C5; alchilsolfonilammino C_1-C_6 , alchilcarbonilammino C_2-C_7 o alcossicarbonilammino C_2 - C_7 , questi ultimi tre gruppi eventualmente sostituiti con gruppi alchilici C1-C4;

- Q1 rappresenta un gruppo eterociclico scelto tra 1,3,4tiadiazol-2-il, 1,3,4-tiadiazol-5-il, 1,2,4-tiadiazol-5tetrazol-5-il, 1,3,4-ossadiazol-2-il, 1,3,4il, ossadiazol-5-il, 1,2,4-ossadiazol-5-il, ossazol-2-il, ossazol-4-il, ossazol-5-il, isossazol-3-il, isossazol-5il, tiazol-2-il, tiazol-4-il, tiazol-5-il, detti gruppi a loro volta eventualmente sostituiti con atomi di alogeno scelti tra cloro, fluoro, bromo o iodio, oppure sostituiti con gruppi scelti tra alchile C1-C6 o aloalchile C_1-C_6 , alchenile C_2-C_6 o aloalchenile C_2-C_6 , alchenilossi C_2 - C_6 o aloalchenilossi C_2 - C_6 , alchinile C_2 - C_6 o aloalchinile C_2 - C_6 , alchinilossi C_2 - C_6 o aloalchinilossi C_2-C_6 , alcossi C_1-C_6 o aloalcossi C_1-C_6 , alcossialchile $C_2 C_6$ o aloalcossialchile C_2 - C_6 , alchiltio aloalchiltio C_1-C_6 , alchilsolfinico C_1-C_6 alolchilsolfinico C₁-C₆, alchilsolfonico C_1-C_6 alolchilsolfonico C_1-C_6 , alcossicarbonile C_2-C_6 aloalcossicarbonile C_2 - C_6 , alcossicarbonilalchile C_3 - C_8 o aloalcossicarbonilalchile C_3-C_8 , alcossicarbonilalcossi C₃-C₈, amminocarbonilalcossi C₃-C₈ eventualmente sostituito con gruppi alchilici C_1-C_4 oppure con un alchilene C_2-C_5 ; CN, CHO, NO₂, NH₂, cianoalchile C_1-C_3 , cianoalchilossi C₁-C₃, alchilcarbonile C_2-C_6 aloalchilcarbonile C_2-C_6 , alcossimminoalchile C_2-C_6 , aloalcossimminoalchile C2-C6, amminocarbonile,

amminocarbonilalchile C_2-C_6 amminosolfonile amminosolfonilalchile $C_2\text{--}C_6$, questi ultimi quattro gruppi eventualmente sostituiti con uno o due gruppi alchilici C_1-C_4 oppure con un alchilene C_2-C_5 ; alchilsolfonilammino C₁-C₆, alchilcarbonilammino C₂-C₇ o alcossicarbonilammino C_2 - C_7 , questi ultimi tre gruppi eventualmente sostituiti con gruppi alchilici C1-C4;

 \mathbb{Q}_2 rappresenta un gruppo eterociclico scelto tra tetrazol-5-il, tiazol-2-il, tiazol-4-il, tiazol-5-il, isotiazol-3-il, isotiazol-4-il, isotiazol-5-il, 1,2,3triazolil, benzossazol-2-il, benzotiazol-2-il, pirimidin-2-il, 1,2,4-triazinil, 1,3,5-triazinil, detti gruppi a loro volta eventualmente sostituiti con atomi di alogeno scelti tra cloro, fluoro, bromo o iodio, oppure sostituiti con gruppi scelti tra alchile C_1-C_6 o aloalchile C_1-C_6 , alchenile C_2-C_6 o aloalchenile C_2-C_6 , alchenilossi C_2 - C_6 o aloalchenilossi C_2 - C_6 , alchinile C_2 - C_6 o aloalchinile $C_2\text{-}C_6$, alchinilossi $C_2\text{-}C_6$ o aloalchinilossi C_2-C_6 , alcossi C_1-C_6 o aloalcossi C_1-C_6 , alcossialchile $C_2 C_6$ o aloalcossialchile C_2 - C_6 , alchiltio C1-C6 C₁-C₆, alchilsolfinico aloalchiltio C1-C6 alolchilsolfinico C₁-C₆, alchilsolfonico C_1-C_6 alolchilsolfonico C_1-C_6 , alcossicarbonile C_2-C_6 aloalcossicarbonile C2-C6, alcossicarbonilalchile C3-C8 o aloalcossicarbonilalchile C3-C8, alcossicarbonilalcossi

amminocarbonilalcossi C3-C8 eventualmente sostituito con gruppi alchilici C1-C4 oppure con un alchilene C_2-C_5 ; CN, CHO, NO₂, NH₂, cianoalchile C_1-C_3 , cianoalchilossi $C_1 - C_3$, alchilcarbonile C2-C6, aloalchilcarbonile C2-C6, alcossimminoalchile C2-C6, aloalcossimminoalchile C2-C67 amminocarbonile, amminocarbonilalchile C_2-C_6 amminosolfonile amminosolfonilalchile C2-C6, questi ultimi quattro gruppi eventualmente sostituiti con uno o due gruppi alchilici C_1-C_4 oppure con un alchilene C_2-C_5 ; alchilsolfonilammino C_1 - C_6 , alchilcarbonilammino C_2 - C_7 o alcossicarbonilammino C_2 - C_7 , questi ultimi tre gruppi eventualmente sostituiti con gruppi alchilici C1-C4.

ulteriore oggetto della presente invenzione l'uso degli uracili di formula generale erbicidi.

Esempi specifici di composti di formula generale (I) interessanti per la loro elevata attività erbicida sono:

- metil (2E) -4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
- il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato;
- (2E) -4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
- il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato;

```
- metil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]feniltio}-3-metossibut-2-enoato;
   etil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}-3-etossibut-2-enoato;
    metil
              (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]feniltio}-3-metossibut-2-enoato;
- etil (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-
etossibut-2-enoato;
      isopropil (2E)-4-\{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-
tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-
(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-
enoato;
   metil
           (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-
metossibut-2-enoato;
   metil
            (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-2,6-
diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-
metossibut-2-enoato;
           (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-
etossibut-2-enoato;
```

- (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-2,6etil diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3etossibut-2-enoato;
- 2,2,2-trifluoroetil $(2E)-4-\{2-cloro-4-fluoro-5-cloro-4-fluoro-6-cloro-4-fluoro-6-cloro-4-fluoro-6-cloro-4-fluoro-6-cloro-4-fluoro-6-cloro-4-fluoro-6-cloro-4-fluoro-6-cloro-4-fluoro-6-cloro-4-fluoro-6-cloro-4-fluoro-6-cloro-4-fluoro-6-cloro-4-fluoro-6-clor$ [1,2,3,6-tetraidro-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-

enoato;

- (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-2,6diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3metossi-N, N-dimetilbut-2-enammide;
- S-etil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3metossibut-2-enetioato;
- isopropil (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato;
- 2,2,2-trifluoroetil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2enoato;
- 2,2,2-trifluoroetil (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2enoato;

S-etil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1il]fenossi}-3-metossibut-2-enetioato; S-etil (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1il]fenossi}-3-metossibut-2-enetioato; - (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3metossi-N, N-dimetilbut-2-enammide; (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3metossi-N, N-dimetilbut-2-enammide; - (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]feniltio}-3metossi-N, N-dimetilbut-2-enammide; (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]feniltio}-3metossi-N, N-dimetilbut-2-enammide; 3-[4-cloro-2-fluoro-5-(tetrazol-5-ilmetossi)fenil]-6-(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione; 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(2-metil-2*H*-tetrazol-5il)metossi]fenil}-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)pirimidindione;

metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;

3-[4-cloro-2-fluoro-5-(tetrazol-5-ilmetossi)fenil]-1-

- 3-[2,4-dicloro-5-(tetrazol-5-ilmetossi)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(2-metil-2*H*-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione;
- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(2-etil-2*H*-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione;
- 3-{2,4-dicloro-5-[(2-metil-2*H*-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione;
- 3-{2,4-dicloro-5-[(2-etil-2*H*-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione;
- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(1-etil-1*H*-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione;
- 3-(2,4-dicloro-5-[(1-etil-1H-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
- 3-{5-[(5-tert-butil-1,3,4-ossadiazol-2-il)metossi]-4-cloro-2-fluorofenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;



```
- metil
            [5-({2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-2, 6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}metil)-1H-tetrazol-1-il]acetato;
   metil [5-({2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}metil)-1H-tetrazol-1-il]acetato;
    metil
            [5-({2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}metil)-2H-tetrazol-2-il]acetato;
   metil [5-({2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}metil)-2H-tetrazol-2-il]acetato;
- 3-[4-cloro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
         3-[4-cloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
         3-[4-cloro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
            3-[4-cloro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
           3-[4-cloro-2-fluoro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
                 3-[2,4-dicloro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
```

```
3-[4-cloro-2-fluoro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
        3-[2,4-dicloro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
- 3-[4-cloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-
6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
            3-[4-cloro-2-fluoro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-
ii)fenil]-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
    3-[2,4-dicloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
            3-[4-cloro-2-fluoro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-
il)fenil]-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
    3-[2,4-dicloro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
            3-[4-cloro-2-fluoro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-
il) fenil] -1-metil-6-(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H)-
pirimidindione;
     3-[2,4-dicloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-1-
metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
    3-[4-cloro-3-(2-etil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-
6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
  3-[4-cloro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-
```

6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;

```
3-[4-cloro-2-fluoro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-
il) fenil] -1-metil-6-(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -
pirimidindione;
     3-[2,4-dicloro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-1-
metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
    3-[4-cloro-3-(1-etil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-
6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
            (5-{2-cloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-
   metil
diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenil}-1H-
tetrazol-1-il)acetato;
            (5-{2-cloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-
diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenil}-2H-
tetrazol-2-il)acetato;
    metil (5-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenil}-1H-tetrazol-1-il)acetato;
    metil
            (5-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenil}-2H-tetrazol-2-il)acetato;
    metil
            (5-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenil}-1H-
tetrazol-1-il) acetato;
    metil (5-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenil}-2H-
tetrazol-2-il)acetato;
```

```
3-[4-cloro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-il)fen;
6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
       3-[2,4-dicloro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tia461-2
il) fenil-6-(trifluorometil)-2, 4(1H, 3H)-pirimidindione
  3-[4-cloro-2-fluoro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
 3-[4-cloro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-il)fenil-
1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
    3-[4-cloro-3-(4-etossi-5-metil-1,3-tiazol-2-il)fenil-
1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
        3-[2,4-dicloro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
         3-[2, 4-dicloro-3-(4-etossi-5-metil-1, 3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
 - 3-[4-cloro-2-fluoro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
     3-[4-cloro-2-fluoro-3-(4-etossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
 il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2, 4(1H, 3H)-
 pirimidindione;
          3-[4-cloro-3-(4-benzilossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
 il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2, 4(1H, 3H)-
 pirimidindione;
```

```
3-[2,4-dicloro-3-(4-benzilossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2, 4(1H, 3H)-
pirimidindione;
         3-[4-cloro-2-fluoro-3-(4-benzilossi-5-metil-1,3-
tiazol-2-il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2, 4(1H, 3H)-
pirimidindione;
- 3-(2,4-dicloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-
2-i1]ossi fenil) -6-(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -
pirimidindione;
        3-(4-cloro-2-fluoro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
tiadiazol-2-il]ossi}fenil)-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
             3-(2,4-dicloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
ossadiazol-2-il]ossi}fenil)-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
        3-(4-cloro-2-fluoro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
ossadiazol-2-il]ossi}fenil)-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
     3-(4-cloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-
il]ossi)fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
 - 3-(2,4-dicloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-
 2-i1}ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
```

pirimidindione;

```
3-(4-cloro-2-fluoro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
tiadiazol-2-il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
             3-{4-cloro-3-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-
il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
            3-{2,4-dicloro-3-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-
il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
       3-{4-cloro-2-fluoro-3-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-
il)ossi[fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2, 4(1H, 3H)-
pirimidindione;
    3-(4-cloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-ossadiazol-2-
il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
             3-(2,4-dicloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
ossadiazol-2-il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
        3-(4-cloro-2-fluoro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
 ossadiazol-2-il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-
 2,4(1H,3H)-pirimidindione;
                3-{4-cloro-3-[(5-metil-1,3,4-ossadiazol-2-
 il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
 pirimidindione;
```

- 3-{2,4-dicloro-3-[(5-metil-1,3,4-ossadiazol-2-il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
- 3-{4-cloro-2-fluoro-3-[(5-metil-1,3,4-ossadiazol-2-il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
- metil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-6-osso-2-tio-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato;
- metil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-difluorometil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato.

Ulteriore oggetto della presente invenzione sono i procedimenti per la preparazione dei composti di formula generale (I).

In particolare, i composti di formula generale (I) possono essere preparati per reazione di un isocianato o isotiocianato di formula generale (II) per ciclocondensazione con un 3-amminocrotonato di formula generale (III) secondo lo schema di reazione 1. Schema 1:

-21 - Ing. Barzanò & Zanardo no S.p.A.

NHR

NHR

COOR₁₃

(III)

(II)

(II)

Nelle formule generali riportate in questo schema ... di reazione:

- X_1 , X_2 , X_3 , X_4 , R e G hanno i significati in precedenza definiti;
- R_{13} rappresenta un gruppo alchilico C_1 - C_4 o aloalchilico C_1 - C_4 o un gruppo fenilico eventualmente sostituito da gruppi alchilici C_1 - C_4 .

La reazione tra i composti di formula generale (II) e i composti di formula generale (III) viene preferibilmente condotta in presenza di un solvente organico inerte e in presenza di una base organica o preferibilmente inorganica, ad una temperatura compresa tra - 20°C e la temperatura di ebollizione della miscela di reazione.

Esempi di solventi utilizzabili per la succitata reazione includono gli idrocarburi alifatici o cicloalifatici (etere di petrolio, esano, cicloesano ecc.), gli idrocarburi clorurati (cloruro di metilene,

cloroformio, tetracloruro di carbonio, dicloroetano ecc.), gli idrocarburi aromatici (benzene, toluene, xilene, clorobenzene, ecc.), gli eteri (dietil etere, diossano, etere, dimetossietano, diisopropil tetraidrofurano, ecc.), gli alcoli e i glicoli (metanolo, etanolo, metilcellosolve, glicole etilenico, (acetone, metiletilchetone, ecc.), i chetoni metilpropilchetone, metilisobutil-chetone, ecc.), i nitrili (acetonitrile, benzonitrile, ecc.), i solventi dipolari aprotici (dimetilformammide, dimetilacetammide, esametilfosforotriammide, dimetilsolfossido, solfolano, N-metilpirrolidone, ecc.).

Basi inorganiche utili allo scopo sono, ad esempio, idruri, idrossidi e carbonati di sodio o potassio.

Basi organiche utili allo scopo sono, ad esempio, la trietilammina, la piridina, la 4-N,N-dimetilamminopiridina, la N,N-dimetilanilina, la N-metilpiperidina, la lutidina, il diazabicicloottano (DABCO), il diazabiciclononene (DBN), il diazabicicloundecene (DBU).

Gli isocianati o isotiocianati di formula generale (II) possono essere preparati a partire da una opportuna anilina sostituita di formula generale (IV) per reazione con un composto di formula generale (V), quale fosgene,

difosgene, trifosgene o tiofosgene, secondo lo schema di reazione 2.

Schema 2:

Nelle formule generali riportate in questo schema di reazione:

- X_1 , X_2 , X_3 e G hanno i significati in precedenza definiti;
- L₃ e L₄, uguali o diversi tra loro rappresentano un atomo di cloro o un gruppo CCl₃O-.

La reazione viene preferibilmente condotta presenza di un solvente organico inerte, temperatura compresa tra 0°C e la temperatura di ebollizione della miscela stessa, eventualmente presenza di un catalizzatore quale la trietilammina, in quantità variabile tra lo 0.001 e il 100% in peso rispetto all'anilina (IV).

Solventi organici inerti utili allo scopo sono, ad esempio, gli idrocarburi clorurati (ad esempio, cloruro

di metilene, cloroformio, 1,2-dicloroetano, ecc.), gli idrocarburi aromatici (ad esempio benzene, toluene, xilene, clorobenzene, ecc.), gli esteri (ad esempio, acetato di etile, ecc.). Nella reazione viene impiegata una quantità di reagente (V) variabile tra 1 e 3 moli per mole di anilina (IV).

I composti di formula generale (I) in cui X3 rappresenta un gruppo Q(CR₁R₂)_nZ-, un gruppo Q₁Z-, un gruppo Y(OC)- CR_6 = CR_5 - CR_3R_4 Z-, composti (Ia), possono anche essere preparati per reazione di un uracile di formula generale (VI) con composto di formula generale (VII) secondo lo schema di reazione 3:

Schema 3:

$$X_{2}$$
 X_{2}
 X_{3}
 X_{4}
 X_{4}
 X_{4}
 X_{5}
 X_{4}
 X_{5}
 X_{7}
 X_{1}
 X_{2}
 X_{2}
 X_{2}
 X_{3}
 X_{4}
 X_{5}
 X_{4}
 X_{5}
 X_{4}
 X_{5}
 X_{5}
 X_{6}
 X_{7}
 X_{8}
 X_{8}
 X_{9}
 X_{1}
 X_{1}
 X_{2}
 X_{2}
 X_{3}
 X_{4}
 X_{5}
 X_{6}
 X_{1}
 X_{2}
 X_{3}
 X_{4}
 X_{5}
 X_{6}
 X_{1}
 X_{2}
 X_{3}
 X_{4}
 X_{5}
 X_{5}
 X_{7}
 X_{8}
 X_{1}
 X_{2}
 X_{3}
 X_{4}
 X_{5}
 X_{5}
 X_{7}
 X_{8}
 X_{8}
 X_{1}
 X_{2}
 X_{2}
 X_{3}
 X_{4}
 X_{1}
 X_{2}
 X_{3}
 X_{4}
 X_{5}
 X_{5}
 X_{5}
 X_{5}
 X_{7}
 X_{8}
 X_{8

Nelle formule generali riportate in questo schema di reazione:

- X_1 , X_2 , X_4 , G e Z hanno i significati in precedenza definiti;

- R rappresenta un gruppo alchilico C_1-C_3 o un gruppo aloalchilico C₁-C₃;
- W rappresenta un gruppo $Q(CR_1R_2)_n$ -, un gruppo Q_1 -, un gruppo $Y(OC)-CR_6=CR_5-CR_3R_4-$, in cui R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , Y, Q e Q₁ hanno i significati precedentemente definiti;
- L₂ rappresenta un atomo di alogeno, un gruppo R_LSO₂O-, in cui R_L rappresenta un gruppo alchilico C_1-C_4 o aloalchilico C1-C4 o un gruppo fenilico eventualmente sostituito da gruppi alchilici C₁-C₄, oppure rappresenta un gruppo R_{L1}SO₂- in cui R_{L1} rappresenta un gruppo alchilico C1-C4 o aloalchilico C1-C4.

La reazione tra i composti di formula generale (VI) i composti di formula generale (VII) preferibilmente condotta in presenza di uno o più solventi organici inerti ed in presenza di una base, preferibilmente inorganica, ad una temperatura compresa tra -10°C e la temperatura di ebollizione della miscela di reazione.

Solventi organici utili allo scopo sono ad esempio gli idrocarburi aromatici (benzene, toluene, xilene, ecc.), eteri (dietil clorobenzene, gli etere, dimetossietano, diossano, diisopropil tetraidrofurano, ecc.), gli alcoli е (metanolo, etanolo, metilcellosolve, glicole etilenico, ecc.), i chetoni (acetone, metiletilchetone,

metilpropilchetone, metilisobutil-chetone, ecc.), i nitrili (acetonitrile, benzonitrile, ecc.), i solventi dipolari aprotici (dimetilformammide, dimetilacetammide, esamétilfosforotriammide, dimetilsolfossido, solfolano, N-metilpirrolidone, ecc.).

Basi inorganiche utili allo scopo sono, ad esempio, idruri, idrossidi e carbonati di sodio o potassio.

La reazione può essere anche vantaggiosamente condotta in un sistema bifasico utilizzando come solventi l'acqua ed un solvente organico immiscibile con essa, in presenza di catalizzatori di trasferimento di fase, secondo quanto descritto da Dehmlow and Dehmlow in "Phase Transfer Catalysis" (1983), Verlag Chemie.

I composti di formula generale (I) in cui G=O ed R≠H, composti (Ic), possono anche essere preparati per reazione di un uracile di formula generale (Ib) con un composto alchilante di formula generale (VIII) secondo lo schema di reazione 4.

Schema 4:

$$X_{2}$$

$$X_{3}$$

$$(Ib)$$

$$R'-L_{1}$$

$$(VIII)$$

$$X_{2}$$

$$X_{3}$$

$$(Ic)$$

Nelle formule generali riportate in questo schema di reazione:

- X₁, X₂, X₃ ed X₄ hanno i significati in precedenza definiti;
- R' rappresenta un gruppo alchilico C_1-C_3 o un gruppo aloalchilico C1-C3;
- L_1 rappresenta un atomo di alogeno, oppure un gruppo $R_{L}SO_{2}O-$ in cui R_{L} rappresenta un gruppo alchilico $C_{1}\text{--}C_{4}$ o aloalchilico C1-C4 o un gruppo fenilico eventualmente sostituito da gruppi alchilici C1-C4.

La reazione tra i composti di formula generale (Ib) formula generale (VIII) i composti di preferibilmente condotta in presenza di uno o più solventi organici inerti ed in presenza di una base, preferibilmente inorganica, ad una temperatura compresa tra -10°C e la temperatura di ebollizione della miscela di reazione.

Solventi organici utili allo scopo sono ad esempio gli idrocarburi aromatici (benzene, toluene, xilene, clorobenzene, ecc.), gli eteri (dietil etere, diisopropil etere, dimetossietano, diossano, tetraidrofurano, ecc.), gli alcoli e i glicoli (metanolo, etanolo, metilcellosolve, glicole etilenico, ecc.), i chetoni (acetone, metiletilchetone, metilpropilchetone, metilisobutil-chetone, ecc.), i nitrili (acetonitrile, benzonitrile, ecc.), i solventi dipolari aprotici (dimetilformammide, dimetilacetammide, esametilfosforotriammide, dimetilsolfossido, solfolano, N-metilpirrolidone, ecc.).

Basi inorganiche utili allo scopo sono, ad esempio, idruri, idrossidi e carbonati di sodio o potassio.

La reazione può essere anche vantaggiosamente condotta in un sistema bifasico utilizzando come solventi l'acqua ed un solvente organico immiscibile con essa, in presenza di catalizzatori di trasferimento di fase, secondo quanto descritto da Dehmlow and Dehmlow in "Phase Transfer Catalysis" (1983), Verlag Chemie.

I composti di formula generale (I) in cui G=O, composti (Id), possono anche essere preparati a partire da una opportuna anilina sostituita di formula (IV) per reazione con un cloroformiato od un carbonato di formula (IX) a dare un carbammato di formula (X); questo può

essere convertito ai composti di formula generale (Id) ciclocondensazione per con un 3-amminocrotonato formula generale (III).

Questa sequenza di reazioni è riportata nello schema 5.

Schema 5:

$$X_{1}$$

$$X_{1}$$

$$X_{1}$$

$$X_{1}$$

$$X_{1}$$

$$X_{2}$$

$$X_{3}$$

$$X_{3}$$

$$X_{3}$$

$$X_{3}$$

$$X_{4}$$

$$X_{5}$$

$$X_{1}$$

$$X_{1}$$

$$X_{1}$$

$$X_{1}$$

$$X_{2}$$

$$X_{3}$$

$$X_{3}$$

$$X_{3}$$

$$X_{4}$$

$$X_{5}$$

$$X_{1}$$

$$X_{2}$$

$$X_{3}$$

$$X_{3}$$

$$X_{4}$$

$$X_{5}$$

$$X_{5}$$

$$X_{6}$$

$$X_{7}$$

$$X_{1}$$

$$X_{1}$$

$$X_{2}$$

$$X_{3}$$

$$X_{3}$$

$$X_{4}$$

$$X_{5}$$

$$X_{5}$$

$$X_{1}$$

$$X_{2}$$

$$X_{3}$$

$$X_{3}$$

$$X_{4}$$

$$X_{5}$$

$$X_{5}$$

$$X_{6}$$

$$X_{7}$$

$$X_{1}$$

$$X_{1}$$

$$X_{2}$$

$$X_{3}$$

$$X_{3}$$

$$X_{4}$$

$$X_{5}$$

$$X_{5}$$

$$X_{7}$$

$$X_{1}$$

$$X_{1}$$

$$X_{2}$$

$$X_{3}$$

$$X_{3}$$

$$X_{4}$$

$$X_{5}$$

$$X_{7}$$

$$X_{1}$$

$$X_{2}$$

$$X_{3}$$

$$X_{3}$$

$$X_{4}$$

$$X_{5}$$

$$X_{5}$$

$$X_{7}$$

$$X_{7$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ X_1 \\ NH \\ OR_{14} \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_2 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_4 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_4 \\ X_3 \\ X_4 \\ X_4 \\ X_3 \end{array}$$

$$\begin{array}{c} X_1 \\ OR_{14} \\ X_4 \\ X_4 \\ X_3 \\ X_4 \\ X_4 \\ X_4 \\ X_5 \\ X_5 \\ X_5 \\ X_7 \\ X_8 \\$$

Nelle formule generali riportate in questo schema di reazione:

- X_1 , X_2 , X_3 , X_4 e R hanno i significati in precedenza definiti;

- L₅ rappresenta un atomo di alogeno od un gruppo OR14
- R_{13} e R_{14} rappresentano un gruppo alchilico C_1 - C_4 o alcalchilico C_1 - C_4 o un gruppo fenilico eventualmente sostituito da gruppi alchilici C_1 - C_4 .

La reazione viene preferibilmente condotta in presenza di un solvente organico inerte, ad una temperatura compresa tra -10°C e la temperatura di ebollizione della miscela stessa, in presenza di una base organica od inorganica, in quantità variabile tra 1 e 1.5 moli per mole di anilina (IV).

Basi inorganiche utili allo scopo sono, ad esempio, sodio carbonato, sodio idrossido, ecc.

Basi organiche utili allo scopo sono, ad esempio, trietilammina, piridina, 4-dimetilamminopiridina, ecc.

Solventi organici inerti utili allo scopo sono, ad esempio, gli idrocarburi clorurati (ad esempio, cloruro di metilene, cloroformio, 1,2-dicloroetano, ecc.), gli idrocarburi aromatici (ad esempio benzene, toluene, xilene, clorobenzene, ecc.), gli eteri (ad esempio, etere etilico, tetraidrofurano, diossano, ecc.), gli esteri (ad esempio, acetato di etile, ecc.).

Nella reazione viene impiegata una quantità di composto di formula (IX) variabile tra 1 e 1.5 moli per mole di anilina (IV).

Le modalità operative, come pure la tipologia di solventi e basi utili per l'effettuazione della reazione di ciclocondensazione di un carbammato di formula generale (X) con un 3-amminocrotonato di formula generale (III) riportata nello schema 5, sono del tutto analoghe a quelle riportate per la reazione dello schema 1.

I composti di formula generale (I) in cui $X_3 = Q_2$ possono anche essere preparati a partire da composti di formula generale (XI)

$$X_2$$
 X_1
 X_2
 X_3
 X_4
 X_4
 X_2
 X_1
 X_2
 X_3
 X_4

in cui:

- X_1 , X_2 , X_4 , R e G hanno i significati in precedenza definiti;
- U rappresenta un gruppo funzionale trasformabile in uno degli anelli eterociclici previsti per Q_2 .

Ad esempio, quando U=CN, $CONH_2$, $CSNH_2$, CO_2H ecc., tali gruppi funzionali possono essere agevolmente

trasformati in gruppi eterociclici secondo modalità note nella prassi della chimica organica.

Esempi specifici di tale strategia, ad esempio a partire dal gruppo funzionale ciano (U = CN), riguardano la preparazione di tetrazoli e tiazoli.

Il gruppo ciano può essere trasformato in un tetrazolo, ad esempio per reazione a caldo trimetilsililazide, in toluene, catalizzata dibutilstagno, secondo quanto descritto in "Journal Organic Chemistry" (1993), vol. 58, pag. 4139-4141, oppure per riscaldamento con sodio azide in acqua e catalisi di ZnBr2, come riportato in "Journal Organic Chemistry" (2001), vol. 66, pag. 7945-7950.

Il gruppo ciano può essere trasformato in tiazolo, esempio per reazione a caldo con acidi mercaptoacetici, secondo quanto descritto in "Journal Medicinal Chemistry" (1991), vol. 34, pag. 2158-2165, oppure per trattamento con α -mercaptochetoni e acido cloridrico gassoso, in benzene, a 0 °C, come riportato in C.A., 1958, vol. 52, 14698.

Gli intermedi di formule generali (III), (V), (VII), (VIII), e (IX) quando non siano già noti di per sé, sono facilmente preparabili secondo metodologie note nella prassi della chimica organica.

In alcuni casi, i composti aventi formula generale (I), possono essere ottenuti sotto forma di due o più isomeri ottici o geometrici o di posizione.



Rientra pertanto nello spirito della presente invenzione, considerare sia i composti aventi formula generale (I) isomericamente puri, sia miscele degli stessi, eventualmente ottenute durante la preparazione dei composti aventi formula generale (I) oppure derivati da una incompleta separazione degli isomeri stessi, in qualsivoglia proporzione.

Come detto, i composti di formula generale (I) sono dotati di una elevata attività erbicida che lì rende adatti all'impiego in campo agrario nella difesa delle colture utili dalle piante infestanti.

In particolare, i composti oggetto della presente invenzione sono efficaci nel controllo, sia in preemergenza che in post-emergenza, di numerose erbe infestanti monocotiledoni e dicotiledoni. Nel contempo, detti composti possono mostrare compatibilità od assenza di effetti tossici nei confronti di colture utili in trattamenti di pre- e/o di post-emergenza.

I composti della presente invenzione possono agire da erbicidi totali o selettivi anche in funzione della quantità di principio attivo impiegata.

Esempi di malerbe che possono essere efficacemente controllate utilizzando i composti aventi formula generale (I) sono: Abutilon theofrasti, Alisma plantago, Amaranthus spp., Amni maius, Capsella bursa pastoris, Chenopodium album, Convolvulus sepium, Galium aparine, Geranium dissectum, Ipomea spp., Matricaria spp., Papaver rhoaes, Phaseolus aureus, Polygonum persicaria, Portulaca oleracea, Sida spinosa, Sinapsis arvensis, Solanum nigrum, Stellaria media, Veronica spp., Viola spp., Xanthium spp., Alopecurus myosuroides, Avena fatua, Cyperus spp., Digitaria sanguinalis, Echinocloa spp., Heleocaris avicularis, Heteranthera spp., Panicum spp., Poa spp., Scirpus spp., Sorghum spp., ecc.

Alle dosi di impiego utili per le applicazioni agrarie, molti dei suddetti composti non hanno mostrato effetti tossici verso una o più colture agrarie importanti quali riso (Oryza sativa), frumento (Triticum sp.), orzo (Hordeum vulgare), mais (Zea mays), soia (Glycine max).

Ulteriore oggetto della presente invenzione è un metodo per il controllo delle erbe infestanti in aree coltivate mediante l'applicazione dei composti aventi formula generale (I).

La quantità di composto da applicare per ottenere l'effetto desiderato può variare in funzione di diversi

fattori quali, ad esempio, il composto utilizzato, la coltura da preservare, la malerba da colpire, il grado di infestazione, le condizioni climatiche, le caratteristiche del suolo, il metodo di applicazione, ecc.

Dosi di composto comprese tra 1g e 1000g per ettaro forniscono, in genere, un sufficiente controllo.

Per gli impieghi in agricoltura è spesso vantaggioso utilizzare composizioni ad attività erbicida contenenti, come sostanza attiva, uno o più composti aventi formula generale (I), eventualmente anche come miscela di isomeri.

Si possono impiegare composizioni che si presentano sotto forma di polveri secche, polveri bagnabili, concentrati emulsionabili, microemulsioni, paste, granulati, soluzioni, sospensioni, ecc.: la scelta del tipo di composizione dipenderà dall'impiego specifico.

Le composizioni vengono preparate secondo metodologie note, per esempio diluendo o sciogliendo la sostanza attiva con un mezzo solvente e/o diluente solido, eventualmente in presenza di tensioattivi.

Come diluenti inerti solidi, o supporti, possono essere utilizzati caolino, allumina, silice, talco, bentonite, gesso, quarzo, dolomite, attapulgite,

montmorillonite, terra di diatomee, cellulosa, amido, ecc.

Come diluenti inerti liquidi possono essere usati acqua, oppure solventi organici quali idrocarburi aromatici (xiloli, miscele di alchilbenzoli, idrocarburi alifatici (esano, cicloesano, idrocarburi aromatici alogenati (clorobenzolo, ecc.), alcoli (metanolo, propanolo, butanolo, ottanolo, ecc.), esteri (acetato di isobutile, ecc.), chetoni (acetone, cicloesanone, acetofenone, isoforone, etilamilchetone, ecc.), oppure oli vegetali o minerali o loro miscele, ecc.

Come tensioattivi possono essere utilizzati bagnanti ed emulsionanti di tipo non-ionico (alchilfenoli polietossilati, alcoli polietossilati, ecc.), anionico (alchilbenzensolfonati, alchilsolfonati, ecc.), cationico (sali quaternari di alchilammonio, ecc.).

Possono inoltre essere aggiunti disperdenti (ad esempio lignina e suoi sali, derivati di cellulosa, alginati, ecc.), stabilizzanti (ad esempio antiossidanti, assorbenti dei raggi ultravioletti, ecc.).

Per ampliare lo spettro d'azione delle suddette composizioni è possibile aggiungere ad esse

altri erbicidi che possono

essere

ingredienti attivi quali, ad esempio, altri erbicidi, fungicidi, insetticidi, acaricidi, fertilizzanti, ecc..

Esempi di

aggiunti alle composizioni contenenti uno o più composti di formula generale (I) sono i seguenti: acetochlor, acifluorfen, aclonifen, AKH-7088, alachlor, amicarbazone, amidosulfuron, alloxydim, ametryn, anilofos, asulam, atrazine, amitrole, azafenidin, azimsulfuron, aziprotryne, BAY MKH 6561, beflubutamid, benazolin, benfluralin, benfuresate, bensulfuron, bensulide, bentazone, benzfendizone, benzobicyclon, benzofenap, benzthiazuron, bifenox, bilanafos, bispyribac-sodium, bromacil, bromobutide, bromofenoxim, butachlor, butafenacil, butamifos, bromoxynil, butenachlor, butralin, butroxydim, butylate, cafenstrole, carbetamide, carfentrazone-ethyl, chlomethoxyfen, chloramben, chlorbromuron, chlorbufam, chlorflurenol, chloridazon, chlorimuron, chlornitrofen, chlorotoluron, chloroxuron, chlorpropham, chlorsulfuron, chlorthal, chlorthiamid, cinidon ethyl, cinmethylin, cinosulfuron, clethodim, clodinafop, clomazone, clomeprop, clopyralid, cloransulam-methyl, cumyluron (JC-940), cyanazine, cycloate, cyclosulfamuron, cycloxydim, cyhalofop-butyl, 2,4-D, 2,4-DB, daimuron, dalapon, desmedipham, desmetryn, dicamba, dichlobenil,

dichlorprop, dichlorprop-P, diclofop, diclosulam, diethatyl, difenoxuron, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopyr, dimefuron, dimepiperate, dimethachlor, dimethametryn, dimethenamid, dinitramine, dinoseb, dinoseb acetate, dinoterb, diphenamid, dipropetryn, diquat, dithiopyr, 1-diuron, eglinazine, endothal, EPTC, esprocarb, ethalfluralin, ethametsulfuron-methyl, ethidimuron, ethiozin (SMY 1500), ethofumesate, ethoxyfen-ethyl (HC-252), ethoxysulfuron, etobenzanid (HW 52), fenoxaprop, fenoxaprop-P, fentrazamide, flamprop, flamprop-M, flazasulfuron, fenuron, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazolate (JV 485), flucarbazone-sodium, fluchloralin, flufenacet, flufenpyr ethyl, flumetsulam, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, flumipropin, fluometuron, fluoroglycofen, fluoronitrofen, flupoxam, flupropanate, flupyrsulfuron, fluridone, flurochloridone, fluroxypyr, flurenol, flurtamone, fluthiacet-methyl, fomesafen, foramsulfuron, fosamine, furyloxyfen, glufosinate, glyphosate, halosulfuron-methyl, haloxyfop, haloxyfop-P-methyl, imazamethabenz, imazamox, hexazinone, imazapic, imazaquin, imazethapyr, imazosulfuron, imazapyr, indanofan, iodosulfuron, ioxynil, isopropalin, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxachlortole, isoxaflutole, isoxapyrifop, KPP-421, lactofen, lenacil,

linuron, LS830556, MCPA, MCPA-thioethyl, MCPB, mecoprop, mecoprop-P, mefenacet, mesosulfuron, mesotrione, metamitron, metazachlor, methabenzthiazuron, methazole, methoprotryne, methyldymron, metobenzuron, metobromuron, metolachlor, S-metolachlor, metosulam, metoxuron, metribuzin, metsulfuron, molinate, monalide, monolinuron, naproanilide, napropamide, naptalam, 330, neburon, nicosulfuron, nipyraclofen, norflurazon, orbencarb, oryzalin, oxadiargyl, oxadiazon, oxasulfuron, oxaziclomefone, oxyfluorfen, paraquat, pebulate, pendimethalin, penoxsulam, pentanochlor, pentoxazone, pethoxamid, phenmedipham, picloram, picolinafen, piperophos, pretilachlor, primisulfuron, prodiamine, profluazol, proglinazine, prometon, prometryne, propachlor, propanil, propaquizafop, propazine, propham, propisochlor, propyzamide, prosulfocarb, prosulfuron, pyraclonil, pyraflufen-ethyl, pyrazogyl (HSA-961),pyrazolynate, pyrazosulfuron, pyrazoxyfen, pyribenzoxim, pyributicarb, pyridafol, pyridate, pyriftalid, pyrithiobac-sodium, pyriminobac-methyl, quinclorac, quizalofop, quizalofop-P, rimsulfuron, quinmerac, sethoxydim, siduron, simazine, simetryn, sulcotrione, sulfentrazone, sulfometuron-methyl, sulfosulfuron, 2,3,6-TBA, TCA-sodium, tebutam, tebuthiuron, tepraloxydim, terbacil, terbumeton, terbuthyl-azine, terbutryn, thenylchlor, thiazafluron, thiazopyr, thidiazimin, thifensulfuron-methyl, thiobencarb, tiocarbazil, tioclorim, tralkoxydim, tri-allate, triasulfuron, triaziflam, tribenuron, triclopyr, trifloxysulfuron, trietazine, trifluralin, triflusulfuron-methyl, tritosulfuron, UBI-C4874, vernolate.

La concentrazione di sostanza attiva nelle suddette composizioni può variare entro un ampio intervallo, a seconda del composto attivo, delle applicazioni a cui sono destinate, delle condizioni ambientali e del tipo di formulazione adottato. In generale, la concentrazione di sostanza attiva è preferibilmente compresa tra 1 e 90%.

Vengono ora forniti alcuni esempi che sono da intendersi come descrittivi e non limitativi presente invenzione.

ESEMPIO 1

metil (2E)-4-(2-cloro-4-fluoro-5-Preparazione di isocianatofenossi)-3-metossibut-2-enoato (Intermedio di formula II).

Triclorometilcloroformiato (1.37 g) qocciolato in una soluzione di metil (2E)-4-(5-ammino-2cloro-4-fluorofenossi)-3-metossibut-2-enoato (2.0 g) in acetato di etile (30 ml). Si lascia in agitazione a temperatura ambiente per una notte. Si concentra sotto vuoto ed il residuo ottenuto (2.3 g) viene utilizzato tal quale nella prova successiva.

ESEMPIO 2

metil (2E) -4-{2-cloro-4-fluoro-5-Preparazione di [1,2,3,6-tetraidro-2,6-diosso-4-(trifluorometil) pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato (Composto N° 1).

In una sospensione di sodio idruro (al 60% in olio minerale) (0.3 in dimetilformammide g) (15 raffreddata a 0 °C e mantenuta in atmosfera inerte, viene gocciolata una soluzione di etil 3-ammino-4,4,4trifluoro-2-butenoato (1.39 g) in dimetilformammide (5 ml) mantenendo la temperatura al di sotto di 5°C. Al termine dell'aggiunta si lascia in agitazione per 1 ora ad una temperatura compresa tra 2 e 4°C. Nella soluzione così ottenuta, e mantenendo la temperatura l'intervallo indicato, si gocciola una soluzione di (2E)-4-(2-cloro-4-fluoro-5-isocianatofenossi)-3metil metossibut-2-enoato (2.3 g), preparato nel precedente esempio 1, in dimetilformammide (7 ml).

La miscela di reazione viene quindi riscaldata ad 80 °C, mantenuta a tale temperatura per 4.5 ore ed infine lasciata in agitazione a temperatura ambiente per una notte. La miscela di reazione viene versata in acqua

(100 ml) ed estratta con acetato di etile (3 x 30 ml). La fase organica si lava con acqua che riunita alla fase acquosa viene acidificata, temperatura di 5°C, con acido cloridrico al 10%. prodotto separatosi viene estratto con acetato di etile seccato sotto vuoto. Si ottengono 2.74 g di prodotto che viene utilizzato tal quale nella prova successiva.

¹H-NMR (CDCl₃): δ a 3.67, 3.69 (2s, 6H, CO₂CH₃, OCH₃); 5.20 (bs, 1H, $CHCO_2Me$); 5.25 (m, 2H, OCH_2); 6.23 (s, 1H, CH uracile); 6.9 (d, 1H, aromatico); 7.3 (d, 1H, aromatico).

ESEMPIO 3

metil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-Preparazione di [1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2enoato (Composto N° 2).

Ad una miscela di metil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-2,6-diosso-4-

(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2enoato (0.89 g), ottenuto nel precedente esempio 2, e carbonato di potassio (0.4 g) in acetone (15 ml) si aggiunge ioduro di metile (0.4 g). La miscela di reazione viene scaldata a riflusso per 5 ore. Dopo evaporazione del solvente si aggiunge acqua (100 ml), si estrae con acetato di etile (2x50 ml), si anidrifica la fase organica con sodio solfato e si concentra sotto vuoto. Il residuo è purificato per cromatografia su colonna di gel di silice eluendo con n-esano/ acetato di etile 6:4. Si ottengono 0.5 g.

¹H-NMR (CDCl₃): δ a 3.53 (bs, 1H, NCH₃); 3.66, 3.67 (2s, 6H, CO₂CH₃, OCH₃); 5.18 (bs, 1H, CHCO₂Me); 5.23 (m, 2H, OCH₂); 6.33 (s, 1H, CH uracile); 6.9 (d, 1H, aromatico); 7.3 (d, 1H, aromatico).

ESEMPIO 4

Preparazione alternativa di metil (2E)-4- $\{2$ -cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi $\}$ -3-metossibut-2-enoato (Composto N° 2).

In una sospensione di sodio idruro (al 60% in olio minerale) (0.65 g) in dimetilformammide (35 ml), raffreddata a 0°C e mantenuta in atmosfera inerte, viene gocciolata una soluzione di etil 4,4,4-trifluoro-3-(metilammino)-2-butenoato (3.25 g) in dimetilformammide (10 ml) mantenendo la temperatura al di sotto di 5°C. Al termine dell'aggiunta si lascia in agitazione per 1 ora ad una temperatura compresa tra 2 e 4°C. Nella soluzione così ottenuta, e mantenendo la temperatura entro l'intervallo indicato, si gocciola una soluzione di metil (2E)-4-(2-cloro-4-fluoro-5-isocianatofenossi)-3-

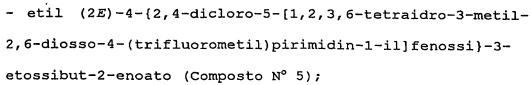
metossibut-2-enoato (5.0 g) in dimetilformammide (10 ml).

La miscela di reazione viene quindi riscaldata a 100°C, mantenuta a tale temperatura per 6 ore ed infine lasciata in agitazione a temperatura ambiente per una notte. La miscela di reazione viene versata in acqua (200 ml) ed estratta con acetato di etile (3 \times 50 ml). La fase organica si lava con acqua che riunita alla acquosa viene acidificata, alla precedente fase temperatura di 5°C, con acido cloridrico al 10%. Il prodotto separatosi viene estratto con acetato di etile seccato sotto vuoto. Il residuo è purificato per cromatografia su colonna di gel di silice eluendo con nesano/ acetato di etile 6:4. Si ottengono 2.1 g di prodotto.

ESEMPIO 5

Sequendo le procedure descritte negli esempi sopra riportati, sono stati preparati i seguenti composti (identificati mediante analisi elementare, ¹H- e ¹⁹F-NMR): $(2E)-4-\{2,4-\text{dicloro}-5-[1,2,3,6-\text{tetraidro}-3$ metil metil-2, 6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1il]fenossi}-3-metossibut-2-enoate (Composto N° 3), p.f. 116°C;

- etil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1il]fenossi}-3-etossibut-2-enoato (Composto N° 4);



ESEMPIO 6

Preparazione di 3-{5-[(5-tert-butil-1,3,4-ossadiazol-2-il)metossi]-4-cloro-2-fluorofenil}-1-metil-6
(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto N° 6);

Ad una miscela di 3-(4-cloro-2-fluoro-5-idrossifenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)pirimidindione (0.40 g) e carbonato di potassio (0.25 g)
in dimetilformammide (5 ml) si aggiunge 2-tert-butil-5(clorometil)-1,3,4-ossadiazolo (0.22 g). La miscela di
reazione viene scaldata a 60°C per 5 ore.

Al termine della reazione la miscela viene versata in acqua (50 ml) ed estratta con acetato di etile (2x30 ml); la fase organica viene lavata con acqua, anidrificata con solfato di sodio e concentrata sotto vuoto. Il residuo è purificato per cromatografia su colonna di gel di silice eluendo con n-esano/ acetato di etile 8:2. Si ottengono 0.24 g di prodotto sotto forma di olio incolore.

¹H-NMR (CDCl₃): δ a 1.41 (s, 9H, C(CH₃)₃); 3.53 (bs, 3H, NCH₃); 5.25 (s, 2H, OCH₂); 6.33 (s, 1H, CH uracile); 7.1 (d, 1H, aromatico); 7.3 (d, 1H, aromatico).

ESEMPIO 7

Seguendo la procedure descritta nell'esempio 6 sono stati preparati i seguenti composti (identificati mediante analisi elementare, ¹H- e ¹⁹F-NMR):

- 3-[4-cloro-2-fluoro-5-(tetrazol-5-ilmetossi)fenil]-1metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione
 (Composto N° 7) p.f. 82°C;
- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-((2-etil-2*H*-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4

 (1*H*,3*H*)-pirimidindione (Composto N° 8) p.f. 126°C;
- $3-\{4-\text{cloro}-2-\text{fluoro}-5-[(1-\text{etil}-1H-\text{tetrazol}-5-\text{il})\text{metossi}]\text{fenil}\}-1-\text{metil}-6-(\text{trifluorometil})-2, 4(1H, 3H)-$ pirimidindione (Composto N° 9) p.f. 60°C;
- metil [5-({2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
- il]fenossi}metil)-1H-tetrazol-1-il]acetato (Composto N° 10) p.f. 243°C;
- metil [5-({2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
- il]fenossi}metil)-2H-tetrazol-2-il]acetato (Composto N° 11) p.f. 65°C;

ESEMPIO 8

Preparazione di etil 4-cloro-3-cianofenilcarbammato (Intermedio di formula X)

Ad una miscela di 5-ammino-2-clorobenzonitrile (5.2 g) e piridina (2.77 g) in cloruro di metilene (75 ml), raffreddata a 0°C e mantenuta in atmosfera inerte, si gocciola una soluzione di cloroformiato di etile (3.68 g) in cloruro di metilene (5 ml) in circa 20 minuti. Al termine dell'aggiunta si lascia in agitazione per 1 ora a 0°C quindi si lascia rinvenire a temperatura ambiente. Al termine della reazione la miscela viene versata in acqua (100 ml) ed estratta con cloruro di metilene (2x80 ml); la fase organica viene lavata con acqua (2x80 ml), anidrificata con solfato di sodio e concentrata sotto vuoto. Si ottengono 7.2 g.

¹H-NMR (CDCl₃): δ a 1.31(t, 3H, CH₃); 4.24 (q, 2H, CH₂); 6.72 (bs, 1H, NH); 7.25-7.82 (m, 3H, aromatici).

ESEMPIO 9

Preparazione di 2-cloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]benzonitrile

In una sospensione di sodio idruro (al 60% in olio minerale) (0.9 g) in dimetilformammide (20 ml), raffreddata a 0°C e mantenuta in atmosfera inerte, viene gocciolata una soluzione di etil 3-ammino-4,4,4-trifluoro-2-butenoato (3.48 g) in dimetilformammide (7 ml) mantenendo la temperatura al di sotto di 5°C. Al

termine dell'aggiunta si lascia in agitazione per 1 ora ad una temperatura compresa tra 0 e 5°C. Nella soluzione così ottenuta, e mantenendo la temperatura entro si gocciola una soluzione di l'intervallo indicato, etil 4-cloro-3-cianofenilcarbamato (4.0 g), preparato nel precedente esempio 8, in dimetilformammide (30 ml).

La miscela di reazione viene quindi riscaldata a 140°C e mantenuta a tale temperatura per 4,5 ore. La miscela di reazione viene versata in acqua (100 ml), portata a pH basico con NaOH al 10% ed estratta con etere etilico (3 x 50 ml). La fase acquosa viene acidificata con acido cloridrico al 10%. Il prodotto separatosi viene estratto con acetato di etile (2x80 ml) anidrificato con solfato di sodio e concentrata sotto vuoto. Si ottengono 6.1 g di prodotto che viene utilizzato tal quale nella prova successiva.

ESEMPIO 10

2-cloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metildi Preparazione 2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]benzonitrile

Ad una miscela 2-cloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-2,6diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]benzonitrile esempio (6.0 g), ottenuto nel precedente bicarbonato di sodio (3.19 g) in acetone (70 ml) aggiunge ioduro di metile (10.8 g). La miscela di reazione viene scaldata a riflusso per 18 ore. Dopo

evaporazione del solvente si aggiunge acqua (200 ml), si estrae con acetato di etile (3x100 ml), si anidrifica la fase organica con sodio solfato e si concentra sotto vuoto. Il residuo è purificato per cromatografia su colonna di gel di silice eluendo con n-esano/ acetato di etile 4:6. Si ottengono 1.9 g.

¹H-NMR (CDCl₃): δ a 3.55 (bs, 3H, NCH₃); 6.38 (s, 1H, CH uracile); 7.4-7.7 (m, 3H, aromatici).

ESEMPIO 11

Preparazione di 3-[4-cloro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto N° 12)

Ad una sospensione di 2-cloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil) pirimidin-1-il]benzonitrile (1.9 g) in toluene (15 ml), si aggiungono trimetilsililazide (1.34 g) e ossido di dibutilstagno (0.3 g).

La miscela di reazione viene scaldata a riflusso per 8 ore. Dopo evaporazione del solvente al rotavapor, il residuo viene trattato con metanolo (30 ml) e concentrato al rotavapor. Il prodotto grezzo ottenuto (2.3 g) viene purificato per digestione con n-esano (30 ml) a temperatura ambiente per 1 ora. Si ottengono 2.1 g di prodotto con punto di fusione > 180°C (dec.).

¹H-NMR (CDCl₃): δ a 3.51 (bs, 3H, NCH₃); 6.39 (s, 1H, CH uracile); 7.5-8.0 (m, 3H, aromatici).

¹⁹F-NMR (CDCl₃): δ a -64,1 (s, 3F, CF₃).

ESEMPIO 12

Preparazione di 3-[4-cloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)
pirimidindione (Composto N° 13) e 3-[4-cloro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)
2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto N° 14);

3-[4-cloro-3-(tetrazol-5-Ad una miscela di il) fenil] -1-metil-6-(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) pirimidindione (1.6 g), ottenuto nel precedente esempio 10, e carbonato di potassio (0.89 g) in acetone (30 ml) si aggiunge ioduro di metile (1.22 g). La miscela di reazione viene scaldata a riflusso per 2 ore. Dopo evaporazione del solvente si aggiunge acqua (100 ml), si estrae con acetato di etile (2x50 ml), si anidrifica la fase organica con sodio solfato e si concentra sotto vuoto. Il residuo è purificato per cromatografia su colonna di gel di silice eluendo con n-esano/ acetato di etile 4:6. Si ottengono 0.55 g di 3-[4-cloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione con punto di fusione di 192°C.

¹H-NMR (CDCl₃): δ a 3.54 (bs, 3H, NCH₃ uracile); 4.42 (bs, 3H, NCH₃ tetrazolo); 6.36 (s, 1H, CH uracile); 7.23-7.94 (m, 3H, aromatici).

e 0.3 g di 3-[4-cloro-3-(1-metil-1*H*-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione con punto di fusione di 185°C,

¹*H*-NMR (CDCl₃): δ a 3.54 (bs, 3*H*, NCH₃ uracile); 4.04 (bs, 3*H*, NCH₃ tetrazolo); 6.36 (s, 1*H*, C*H* uracile); 7.2-7.7 (m, 3*H*, aromatici).

L'attribuzione delle strutture è stata fatta sulla base degli spettri NMR.

ESEMPIO 13

Seguendo la procedura descritta nell'esempio 12 sono stati preparati i seguenti composti (identificati mediante analisi elementare, ¹H- e ¹⁹F-NMR):

- 3-[4-cloro-3-(2-etil-2*H*-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione (Composto N° 15) p.f. 136 °C;
- 3-[4-cloro-3-(1-etil-1*H*-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione (Composto N° 16) p.f. 202 °C;
- metil (5-{2-cloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenil}-2H-tetrazol-2-il)acetato (Composto N° 17) p.f. 172 °C;

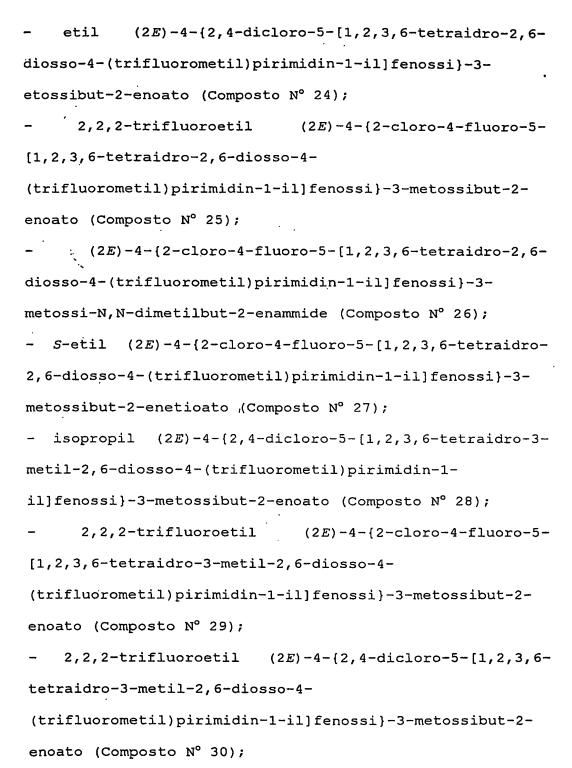
- metil (5-{2-cloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenil}-1H-tetrazol-1-il)acetato (Composto N° 18) p.f. 130 °C.

Seguendo opportune procedure, alcune delle quali sono state esemplificate negli esempi precedenti, sono stati preparati i seguenti composti (identificati mediante analisi elementare, ¹H- e ¹⁹F-NMR):

- metil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil) pirimidin-1-il]feniltio}-3-metossibut-2-enoato (Composto N° 19);
- metil (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]feniltio}-3-metossibut-2-enoato (Composto N° 20);
- isopropil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4- (trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-

enoato (Composto N° 21);

- metil $(2E)-4-\{2,4-\text{dicloro}-5-[1,2,3,6-\text{tetraidro}-2,6-\text{diosso}-4-(\text{trifluorometil})\text{pirimidin}-1-il]\text{fenossi}-3-$ metossibut-2-enoato (Composto N° 22);
- etil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3etossibut-2-enoato (Composto N° 23);





```
S-etil (2E)-4-\{2-\text{cloro}-4-\text{fluoro}-5-\{1,2,3,6-\text{tetraidro}-5-\{1,2,3,6-\text{tetraidro}-5-\{1,2,3,6-\text{tetraidro}-6-\}\}
3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}-3-metossibut-2-enetioato (Composto N° 31);
    S-etil
               (2E)-4-\{2,4-\text{dicloro}-5-[1,2,3,6-\text{tetraidro}-3-
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}-3-metossibut-2-enetioato (Composto N° 32);
   (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-
metossi-N, N-dimetilbut-2-enammide (Composto N° 33);
    (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-
diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-
metossi-N, N-dimetilbut-2-enammide (Composto N° 34);
- (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]feniltio}-3-
metossi-N, N-dimetilbut-2-enammide (Composto Nº 35);
     (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-
diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]feniltio}-3-
metossi-N, N-dimetilbut-2-enammide (Composto N° 36);
     3-[4-cloro-2-fluoro-5-(tetrazol-5-ilmetossi)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) - pirimidindione
                                                 (Composto Nº
38);
           3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(2-metil-2H-tetrazol-5-
il)metossi]fenil}-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto Nº 39);
```

```
3-[2,4-dicloro-5-(tetrazol-5-ilmetossi)fenil]-1-metil-
6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto N°
40);
           3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(2-metil-2H-tetrazol-5-
il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 41), p.f. 167°C;
                3-{2,4-dicloro-5-[(2-metil-2H-tetrazol-5-
il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 42);
                 3-{2,4-dicloro-5-[(2-etil-2H-tetrazol-5-
il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 43);
                 3-{2,4-dicloro-5-[(1-etil-1H-tetrazol-5-
il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 44);
           [5-({2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}metil)-1H-tetrazol-1-il]acetato (Composto
45);
   metil [5-({2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}metil)-2H-tetrazol-2-il]acetato (Composto
46);
- 3-[4-cloro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-6-(trifluorometil)-
2, 4(1H, 3H) -pirimidindione (Composto N° 47);
```

```
3-[4-cloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto N°
48);
        3-[4-cloro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione (Composto N°
49);
           3-[4-cloro-2-fluoro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione (Composto N°
50);
                3-[2,4-dicloro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione (Composto N°
51);
- 3-[4-cloro-2-fluoro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-
(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto N°
52);
        3-[2,4-dicloro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione (Composto
53);
            3-[4-cloro-2-fluoro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-
il) fenil]-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione
(Composto N° 54);
     3-[2,4-dicloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto N°
55);
```

```
3-[4-cloro-2-fluoro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-
il)fenil]-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione
(Composto N° 56);
     3-[2,4-dicloro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione (Composto
57);
            3-[4-cloro-2-fluoro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-
il) fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto Nº 58);
     3-[2,4-dicloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-1-
metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione
(Composto N° 59);
            3-[4-cloro-2-fluoro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-
il) fenil] -1-metil-6-(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -
pirimidindione (Composto N° 60);
     3-[2,4-dicloro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-1-
metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione
(Composto N° 61);
             (5-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
     metil
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il|fenil}-1H-tetrazol-1-il)acetato (Composto Nº 62);
     metil (5-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
 metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
 illfenil}-2H-tetrazol-2-il)acetato (Composto Nº 63);
```

```
(5-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
   metil
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenil}-1H-
tetrazol-1-il)acetato (Composto Nº 64);
          (5-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
   metil
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenil}-2H-
tetrazol-2-il)acetato (Composto Nº 65);
- 3-[4-cloro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-il)fenil-
6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto Nº
66);
        3-[2,4-dicloro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione
(Composto N° 67);
- 3-[4-cloro-2-fluoro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione
 (Composto N° 68);
 - 3-[4-cloro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-il)fenil-
 1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione
 (Composto N° 69);
     3-[4-cloro-3-(4-etossi-5-metil-1,3-tiazol-2-il)fenil-
 1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione
 (Composto N° 70);
         3-[2,4-dicloro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
 il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
 pirimidindione (Composto N° 71);
```

```
3-[2,4-dicloro-3-(4-etossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2, 4(1H, 3H)-
pirimidindione (Composto N° 72);
   3-[4-cloro-2-fluoro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 73);
    3-[4-cloro-2-fluoro-3-(4-etossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2, 4(1H, 3H)-
pirimidindione (Composto Nº 74);
         3-[4-cloro-3-(4-benzilossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 75);
     3-[2,4-dicloro-3-(4-benzilossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 76);
         3-[4-cloro-2-fluoro-3-(4-benzilossi-5-metil-1,3-
tiazol-2-il)fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 77);
- 3-(2,4-dicloro-3-([5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-
2-i1] ossifenil) -6-(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -
pirimidindione (Composto N° 78);
        3-(4-cloro-2-fluoro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
tiadiazol-2-il]ossi}fenil)-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto N° 79);
```

```
3-(2,4-dicloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
ossadiazol-2-il]ossi}fenil)-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto Nº 80);
        3-(4-cloro-2-fluoro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
ossadiazol-2-il]ossi}fenil)-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto N° 81);
     3-(4-cloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-
il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto Nº 82);
- 3-(2,4-dicloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-
2-il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 83);
        3-(4-cloro-2-fluoro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
tiadiazol-2-il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto N° 84);
                 3-{4-cloro-3-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-
il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 85);
             3-{2,4-dicloro-3-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-
 il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
 pirimidindione (Composto N° 86);
        3-{4-cloro-2-fluoro-3-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-
 il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
 pirimidindione (Composto N° 87);
```

```
3-(4-cloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-ossadiazol-2
il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 88);
             3-(2,4-dicloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
ossadiazol-2-il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto Nº 89);
        3-(4-cloro-2-fluoro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
ossadiazol-2-il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione (Composto N° 90);
               3-{4-cloro-3-[(5-metil-1,3,4-ossadiazol-2-
il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 91);
           3-{2,4-dicloro-3-[(5-metil-1,3,4-ossadiazol-2-
il) ossifenil}-1-metil-6-(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H)-
pirimidindione (Composto Nº 92);
      3-{4-cloro-2-fluoro-3-[(5-metil-1,3,4-ossadiazol-2-
il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione (Composto N° 93);
- metil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-6-osso-2-tio-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato (Composto N° 94);
- metil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
difluorometil-2, 6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
 il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato (Composto Nº 95).
ESEMPIO 15
```

Determinazione dell'attività erbicida e della fitotossicità in pre-emergenza.

L'attività erbicida dei composti dell'invenzione in pre-emergenza è stata valutata secondo le seguenti modalità operative.

Le specie vegetali di interesse (erbe infestanti o colture) sono state seminate in vasetti aventi diametro superiore di 10 cm, altezza di 10 cm e contenenti terreno sabbioso. Sono stati utilizzati 10 vasetti per ogni specie vegetale.

Ad ogni vasetto è stata aggiunta acqua in quantità idonea alla germinazione dei semi. I vasetti sono stati quindi divisi in due gruppi ognuno contenente 5 vasetti per ciascuna infestante o coltura.

Dopo un giorno dalla semina il primo gruppo di vasetti è stato trattato con una dispersione idro-acetonica contenente acetone al 10% in volume, il prodotto in valutazione alla concentrazione desiderata e Tween 20 allo 0.5%.

Il secondo gruppo è stato trattato soltanto con una soluzione idroacetonica contenente acetone al 10% in volume e Tween 20 allo 0.5%, ed è stato impiegato come termine di confronto (testimone).

Tutti i vasetti sono stati mantenuti sotto osservazione in ambiente condizionato alle seguenti condizioni ambientali:

- temperatura: 24°C;
- umidità relativa: 60%;
- fotoperiodo: 16 ore;
- intensità luminosa: 10000 lux.

Ogni due giorni i vasetti sono stati uniformemente innaffiati in modo da assicurare un grado di umidità sufficiente per un buon sviluppo delle piante.

Dopo quindici giorni dal trattamento è stata valutata l'attività erbicida in base alla seguente scala di valori che si riferisce alla percentuale di danno rilevato sulle piante trattate rispetto a quelle non trattate (testimone):

- -0 = 0 10 % di danno;
- 1 = 11 30 % di danno;
- -2 = 31 50 % di danno;
- -3 = 51 70 % di danno;
- -4 = 71 90 % di danno;
- 5 = 91 % di danno morte della pianta.

In tabella 1 sono riportati i risultati ottenuti trattando con i composti 2, 6 e 13 alla dose di 15 g/ha le specie vegetali sotto riportate:

Abutilon theofrasti (AT); Amaranthus retroflexus (AR); Chenopodium album (CA); Convolvulus sepium (CS); Galium aparine (GA); Ipomea purpurea (IP); Portulaca oleracea (PO); Solanum nigrum (SN); Sida spinosa (SS).

Tabella 1: Attività erbicida in pre-emergenza alla dose di 15 g/ha

Specie vegetale	АТ	AR	CA	cs	GA	IP	PO	SN	SS
Composto N° 2	5	5	5	5	5	5	5	5	5
Composto N° 6	5	4	5	_	5	4	5	5	5
Composto N° 13	5	5	5	_	5	5	5	5	5

ESEMPIO 16

Determinazione dell'attività erbicida e della fitotossicità in post-emergenza.

L'attività erbicida dei composti dell'invenzione in post-emergenza è stata valutata secondo le seguenti modalità opérative.

Le specie vegetali di interesse (erbe infestanti o colture) sono state seminate in vasetti aventi diametro superiore di 10 cm, altezza di 10 cm e contenenti terreno sabbioso. Sono stati utilizzati 10 vasetti per ogni specie vegetale.

Ad ogni vasetto è stata aggiunta acqua in quantità idonea alla germinazione dei semi. I vasetti sono stati quindi divisi in due gruppi ognuno contenente 5 vasetti per ciascuna infestante o coltura.

Dopo quindici giorni dalla semina (dieci nel caso del frumento), quando cioè le piantine infestanti e le colture, a seconda della specie, avevano un'altezza di 10-15 cm, il primo gruppo di vasetti è stato trattato con una dispersione idro-acetonica contenente acetone al 10% in volume, il prodotto in valutazione alla concentrazione desiderata e Tween 20 allo 0.5%.

Il secondo gruppo è stato trattato soltanto con una soluzione idroacetonica contenente acetone al 10% in volume e Tween 20 allo 0.5%, ed è stato impiegato come termine di confronto (testimone).

Tutti i vasetti sono stati mantenuti sotto osservazione in ambiente condizionato alle seguenti condizioni ambientali:

- temperatura: 24°C;
- umidità relativa: 60%;
- fotoperiodo: 16 ore;
- intensità luminosa: 10000 lux.

Ogni due giorni i vasetti sono stati uniformemente innaffiati in modo da assicurare un grado di umidità sufficiente per un buon sviluppo delle piante.

Dopo quindici giorni dal trattamento è stata valutata l'attività erbicida in base alla seguente scala

C10,33 Euro BIG

di valori che si riferisce alla percentuale di danno rilevato sulle piante trattate rispetto a quelle non trattate (testimone):

- 0 10 % di danno;
- 11 30 % di danno;
- 2 = 31 50 % di danno;
- 51 70 % di danno;
- 71 90 % di danno;
- 91 % di danno morte della pianta.

In tabella 2 sono riportati i risultati ottenuti trattando con i composti 2, 6 e 13 alla dose di 15 le specie vegetali sotto riportate:

Abutilon theofrasti (AT); Amaranthus retroflexus (AR); Chenopodium album (CA); Convolvulus sepium (CS); Galium aparine (GA); Ipomea purpurea (IP); Portulaca oleracea (PO); Solanum nigrum (SN); Sida spinosa (SS).

Tabella 2: Attività erbicida in post-emergenza alla dose di 15 g/ha

Specie vegetale	АТ	AR	CA	CS	GΑ	ΙP	PO	SN	SS
Composto N° 2	5	5	5	5	5	5	4	5	5
Composto N° 6	5	3	4	_	_	5	4	5	4
Composto N° 13	5	5	5	_	-	5	5	5	5

Ing. Barzanò & Zanardo Milano S.p.A.

RIVENDICAZIONI

1. Uracili aventi formula generale (I):

$$X_2$$
 X_3
 X_4

(I)

in cui:

- X_1 rappresenta un atomo di idrogeno od un atomo di alogeno;
- X2 rappresenta un atomo di alogeno;
- X4 rappresenta un gruppo aloalchilico C1-C3;
- R rappresenta un atomo di idrogeno, un gruppo alchilico C_1-C_3 od un gruppo aloalchilico C_1-C_3 ;
- G rappresenta un atomo di ossigeno od un atomo di zolfo;
- X_3 rappresenta un gruppo $Q(CR_1R_2)_nZ$ -, un gruppo Q_1Z , un gruppo Q_2 -, un gruppo $Y(OC)-CR_6=CR_5-CR_3R_4Z$ -;
- Z rappresenta un atomo di ossigeno od un atomo di zolfo;

- R₃ e R₄, uguali o diversi tra rappresentano un atomo di idrogeno, un gruppo alchilico · C₁-C₄ od un gruppo aloalchilico C₁-C₄;
 - R₅ rappresenta un gruppo OR₇;
 - R6 rappresenta un atomo di idrogeno od un gruppo alchilico C1-C4;
 - R_7 rappresenta un gruppo alchilico C_1 - C_4 o un gruppo aloalchilico C1-C4;
 - Y rappresenta un gruppo OR8, un gruppo SR9, un gruppo NR₁₀R₁₁;
 - R_{θ} e R_{9} rappresentano un atomo di idrogeno, un gruppo alchilico C₁-C₆ lineare o ramificato, un gruppo aloalchilico C₁-C₆ lineare o ramificato, un gruppo cicloalchilico C3-C6, un gruppo cicloalchilalchilico C4- C_9 , un gruppo cianoalchilico C_3-C_6 , un alcossialchilico C3-C6, un gruppo ossetanilico, un gruppo tetraidrofuranilico; un gruppo fenilico, un fenilalchilico C7-C12 o un gruppo piridilico, detti gruppi a loro volta eventualmente sostituiti con uno o più atomi di alogeno scelti tra cloro, fluoro, bromo o iodio, oppure sostituiti con uno o più gruppi scelti tra alchile C_1-C_4 o aloalchile C_1-C_4 , alcossi C_1-C_4 o aloalcossi C1-C4;
 - R₁₀ e R₁₁, uguali o diversi tra loro, rappresentano un atomo di idrogeno, oppure un gruppo alchilico C1-C6, un

10,33 Euro

gruppo aloalchilico C1-C6, un gruppo cicloalchilico C3-C6; un gruppo arilalchilico C_1-C_{12} oppure un gruppo arilico $\frac{1}{2}$ detti gruppi a loro volta eventualmente sostituiti con uno o più atomi di alogeno scelti tra cloro, fluoro, bromo o iodio, oppure sostituiti con uno o più gruppi scelti tra alchile C1-C4 o aloalchile C1-C4, alcossi C1-C4 o aloalcossi C1-C4; oppure insieme rappresentano una catena alchilenica C2-C7 eventualmente sostituita da gruppi alchilici C1-C4 ed eventualmente interrotta da atomi di ossigeno o da un gruppo NR12 in cui:

- R_{12} rappresenta un atomo di idrogeno, un gruppo alchilico C_1-C_6 o aloalchilico C_1-C_6 , gruppo alchenilico C₃-C₆ o aloalchenilico C₃-C₆, un gruppo alchinilico C₃-C₆ o aloalchinilico C₃-C₆, un gruppo alcossialchilico C2-C8 o aloalcossialchilico C2-C8, un gruppo alchilcarbonilico C2-C7 o aloalchilcarbonilico C2-C7;
- n rappresenta 1, 2 oppure 3;
- Q rappresenta un gruppo eterociclico scelto tra pirrol-2-il, pirrol-3-il, imidazol-2-il, imidazol-4-il, imidazol-5-il, pirazol-3-il, pirazol-4-il, pirazol-5-il, 1,2,4-triazol-3-il, 1,2,4-triazol-5-il, 1,2,4-triazol-3onil, 1,2,3-triazolil, tetrazolil, ossazolil, isossazol-5-il, tiazol-2-il, tiazol-5-il, isotiazolil, 1,3,4ossadiazolil, 1,3,4-tiadiazolil, 1,2,4-tiadiazolil,

1,2,4-ossadiazolil, 1,2,4-ossadiazol-5-on-3-il, benzossazol-2-il, benzotiazol-2-il, pirazinil, piridazinil, 1,2,4-triazinil, detti gruppi a loro volta eventualmente sostituiti con atomi di alogeno scelti tra cloro, fluoro, bromo o iodio, oppure sostituiti con gruppi scelti tra alchile C1-C6 o aloalchile C1-C6, alchenile C2-C6 o aloalchenile C2-C6, alchenilossi C2-C6 o aloalchenilossi C_2 - C_6 , alchinile C_2 - C_6 o aloalchinile C_2 -C₆, alchinilossi C₂-C₆ o aloalchinilossi C₂-C₆, alcossi C₁aloalcossi C_1-C_6 , alcossialchile C_2-C_6 o C_6 aloalcossialchile C2-C6, alchiltio C1-C6 o aloalchiltio C1- C_6 , alchilsolfinico C_1 - C_6 o alolchilsolfinico C_1 - C_6 , alchilsolfonico C₁-C₆ o alolchilsolfonico $C_1 - C_6$, alcossicarbonile C2-C6 o aloalcossicarbonile C2-C6, alcossicarbonilalchile C3-C8 o aloalcossicarbonilalchile C_3-C_6 , alcossicarbonilalcossi C_3-C_8 , amminocarbonilalcossi C3-C8 eventualmente sostituito con gruppi alchilici C1-C4 oppure con un alchilene C2-C5; CN, CHO, NO2, NH2, cianoalchile C₁-C₃, cianoalchilossi C_1-C_3 alchilcarbonile C2-C6, aloalchilcarbonile C2-C6, alcossimminoalchile C_2-C_6 , aloalcossimminoalchile C_2-C_6 , amminocarbonile, amminocarbonilalchile C_2-C_6 amminosolfonile o amminosolfonilalchile C2-C6, questi ultimi quattro gruppi eventualmente sostituiti con uno o due gruppi alchilici C1-C4 oppure con un alchilene C2-C5;

alchilsolfonilammino C_1-C_6 , alchilcarbonilammino C_2-C_7 o alcossicarbonilammino C2-C7, questi ultimi tre gruppi eventualmente sostituiti con gruppi alchilici C1-C4; - Q1 rappresenta un gruppo eterociclico scelto tra 1,3,4tiadiazol-2-il, 1,3,4-tiadiazol-5-il, 1,2,4-tiadiazol-5tetrazol-5-il, 1,3,4-ossadiazol-2-il, ossadiazol-5-il, 1,2,4-ossadiazol-5-il, ossazol-2-il, ossazol-4-il, ossazol-5-il, isossazol-3-il, isossazol-5il, tiazol-2-il, tiazol-4-il, tiazol-5-il, detti gruppi a loro volta eventualmente sostituiti con atomi di alogeno scelti tra cloro, fluoro, bromo o iodio, oppure sostituiti con gruppi scelti tra alchile C_1 - C_6 o aloalchile C_1-C_6 , alchenile C_2-C_6 o aloalchenile C_2-C_6 , alchenilossi C2-C6 o aloalchenilossi C2-C6, alchinile C2-C6 o aloalchinile C2-C6, alchinilossi C2-C6 o aloalchinilossi C_2 - C_6 , alcossi C_1 - C_6 o aloalcossi C_1 - C_6 , alcossialchile C_2 - C_6 o aloalcossialchile C_2 - C_6 , alchiltio C1-C6 aloalchiltio C_1-C_6 , alchilsolfinico C_1-C_6 alolchilsolfinico C₁-C₆, alchilsolfonico C_1-C_6 alolchilsolfonico C₁-C₆, alcossicarbonile C₂-C₆ aloalcossicarbonile C_2 - C_6 , alcossicarbonilalchile C_3 - C_6 o aloalcossicarbonilalchile C3-C8, alcossicarbonilalcossi C₃-C₈, amminocarbonilalcossi C₃-C₈ eventualmente sostituito con gruppi alchilici C1-C4 oppure con un alchilene C2-C5; CN, CHO, NO2, NH2, cianoalchile C1-C3,

cianoalchilossi C₁-C₃, alchilcarbonile C2-C6, aloalchilcarbonile C₂-C₆, alcossimminoalchile aloalcossimminoalchile C_2-C_6 amminocarbonile, amminocarbonilalchile C_2-C_6 amminosolfonile amminosolfonilalchile C2-C6, questi ultimi quattro gruppi eventualmente sostituiti con uno o due gruppi alchilici C_1-C_4 oppure con un alchilene C_2-C_5 ; alchilsolfonilammino C_1-C_6 , alchilcarbonilammino C_2-C_7 o alcossicarbonilammino C_2-C_7 , questi ultimi tre gruppi eventualmente sostituiti con gruppi alchilici C1-C4;

- Q₂ rappresenta un gruppo eterociclico scelto tra tetrazol-5-il, tiazol-2-il, tiazol-4-il, tiazol-5-il, isotiazol-3-il, isotiazol-4-il, isotiazol-5-il, 1,2,3triazolil, benzossazol-2-il, benzotiazol-2-il, pirimidin-2-il, 1,2,4-triazinil, 1,3,5-triazinil, detti gruppi a loro volta eventualmente sostituiti con atomi di alogeno scelti tra cloro, fluoro, bromo o iodio, oppure sostituiti con gruppi scelti tra alchile C1-C6 o aloalchile C_1-C_6 , alchenile C_2-C_6 o aloalchenile C_2-C_6 , alchenilossi C2-C6 o aloalchenilossi C2-C6, alchinile C2-C6 o aloalchinile C2-C6, alchinilossi C2-C6 o aloalchinilossi C_2-C_6 , alcossi C_1-C_6 o aloalcossi C_1-C_6 , alcossialchile $C_2 C_6$ o aloalcossialchile C_2-C_6 , alchiltio C_1-C_6 aloalchiltio C₁-C₆, alchilsolfinico C1-C6 alolchilsolfinico C_1-C_6 , alchilsolfonico C_1-C_6

alolchilsolfonico C_1-C_6 alcossicarbonile C2-C6 aloalcossicarbonile C2-C6, alcossicarbonilalchile C3-C8 o aloalcossicarbonilalchile C_3-C_8 , alcossicarbonilalcoss C_3-C_8 amminocarbonilalcossi eventualmente (C3-C8 sostituito con gruppi alchilici C1-C4 oppure con un alchilene C2-C5; CN, CHO, NO2, NH2, cianoalchile C1-C3, cianoalchilossi $C_1 - C_3$, alchilcarbonile aloalchilcarbonile C2-C6, alcossimminoalchile C2-C6, aloalcossimminoalchile C2-C6, amminocarbonile, amminocarbonilalchile C2-C6, amminosolfonile amminosolfonilalchile C2-C6, questi ultimi quattro gruppi eventualmente sostituiti con uno o due gruppi alchilici C_1-C_4 oppure con un alchilene C_2-C_5 ; alchilsolfonilammino C_1-C_6 , alchilcarbonilammino C_2-C_7 o alcossicarbonilammino C_2-C_7 , questi ultimi tre gruppi eventualmente sostituiti con gruppi alchilici C1-C4.

- 2. Uracili secondo la rivendicazione 1 caratterizzati dal fatto di essere scelti tra:
- metil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
- il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato;
- metil (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
- il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato;

```
- metil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]feniltio}-3-metossibut-2-enoato;
   etil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}-3-etossibut-2-enoato;
    metil
              (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]feniltio}-3-metossibut-2-enoato;
- etil (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-
etossibut-2-enoato;
      isopropil
                     (2E)-4-\{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-
tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-
(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-
enoato;
           (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-
metossibut-2-enoato;
    metil
            (2E) -4-{2, 4-dicloro-5-[1, 2, 3, 6-tetraidro-2, 6-
diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-
metossibut-2-enoato;
    etil
          (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-
etossibut-2-enoato;
```

- etil (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-2,6diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3etossibut-2-enoato;
- 2,2,2-trifluoroetil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato;
- (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossi-N,N-dimetilbut-2-enammide;
- S-etil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-enetioato;
- isopropil (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato;
- 2,2,2-trifluoroetil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato;
- 2,2,2-trifluoroetil (2E)-4-{2,4-dicloro-5-{1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4- (trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato;

- S-etil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-enetioato;
 S-etil (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
- metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1il]fenossi}-3-metossibut-2-enetioato;
- (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossi-N,N-dimetilbut-2-enammide;
- (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossi-N,N-dimetilbut-2-enammide;
- (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il}feniltio}-3-metossi-N,N-dimetilbut-2-enammide;
- (2E)-4-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]feniltio}-3-metossi-N,N-dimetilbut-2-enammide;
- 3-[4-cloro-2-fluoro-5-(tetrazol-5-ilmetossi)fenil]-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-{(2-metil-2*H*-tetrazol-5-il)metossi}fenil}-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione;
- 3-[4-cloro-2-fluoro-5-(tetrazol-5-ilmetossi)fenil]-1metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;

10.33 Euro

- 3-[2,4-dicloro-5-(tetrazol-5-ilmetossi)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(2-metil-2*H*-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione;
- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(2-etil-2*H*-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione;
- 3-{2,4-dicloro-5-[(2-metil-2*H*-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione;
- 3-{2,4-dicloro-5-[(2-etil-2*H*-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione;
- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(1-etil-1*H*-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione;
- 3-{2,4-dicloro-5-[(1-etil-1*H*-tetrazol-5-il)metossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1*H*,3*H*)-pirimidindione;
- 3-{5-[(5-tert-butil-1,3,4-ossadiazol-2-il)metossi]-4-cloro-2-fluorofenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;

```
[5-({2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
   metil
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}metil)-1H-tetrazol-1-il]acetato;
         [5-({2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
   metil
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}metil)-1H-tetrazol-1-il]acetato;
            [5-({2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
   metil
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
illfenossi}metil)-2H-tetrazol-2-il]acetato;
           [5-({2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
   metil
2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenossi}metil)-2H-tetrazol-2-il]acetato;
- 3-[4-cloro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
         3-[4-cloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-6-
 (trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
          3-[4-cloro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-6-
 (trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
             3-[4-cloro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-
 (trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
            3-[4-cloro-2-fluoro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-6-
 (trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
                 3-[2,4-dicloro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-6-
 (trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
```

```
3-[4-cloro-2-fluoro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
       3-[2,4-dicloro-3-(tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
  3-[4-cloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-
6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
            3-[4-cloro-2-fluoro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-
il) fenil]-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
     3-[2,4-dicloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4 (1H, 3H) -pirimidindione;
            3-[4-cloro-2-fluoro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-
il)fenil]-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
    3-[2,4-dicloro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-6-
(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -pirimidindione;
            3-[4-cloro-2-fluoro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-
il) fenil] -1-metil-6-(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -
pirimidindione;
     3-[2,4-dicloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-1-
metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
    3-[4-cloro-3-(2-etil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-
6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
- 3-[4-cloro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-
```

6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;

```
3-[4-cloro-2-fluoro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-
il) fenil] -1-metil-6-(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -
pirimidindione;
     3-[2,4-dicloro-3-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-1-
metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
    3-[4-cloro-3-(1-etil-1H-tetrazol-5-il)fenil]-1-metil-
6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
            (5-{2-cloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-
    metil
diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenil}-1H-
tetrazol-1-il) acetato;
            (5-{2-cloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-2,6-
   metil
diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenil}-2H-
tetrazol-2-il)acetato;
    metil (5-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenil}-1H-tetrazol-1-il)acetato;
              (5-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-
metil-2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-
il]fenil}-2H-tetrazol-2-il)acetato;
             (5-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
    metil
 2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenil}-1H-
 tetrazol-1-il)acetato;
           (5-{2,4-dicloro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-
    metil
```

2,6-diosso-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenil}-2H-

tetrazol-2-il)acetato;

```
3-[4-cloro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-il)fenil-
6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
        3-[2,4-dicloro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
   3-[4-cloro-2-fluoro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
 3-[4-cloro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-il) fenil-
1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
    3-[4-cloro-3-(4-etossi-5-metil-1,3-tiazol-2-il)fenil-
1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
        3-[2,4-dicloro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
         3-[2,4-dicloro-3-(4-etossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2, 4(1H, 3H)-
pirimidindione;
- 3-[4-cloro-2-fluoro-3-(4-metossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2, 4(1H, 3H)-
pirimidindione;
     3-[4-cloro-2-fluoro-3-(4-etossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
 il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
 pirimidindione;
          3-[4-cloro-3-(4-benzilossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
 il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
 pirimidindione;
```

```
3-[2,4-dicloro-3-(4-benzilossi-5-metil-1,3-tiazol-2-
il) fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
         3-[4-cloro-2-fluoro-3-(4-benzilossi-5-metil-1,3-
tiazol-2-il)fenil-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
- 3-(2,4-dicloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-
2-il]ossi}fenil)-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
        3-(4-cloro-2-fluoro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
tiadiazol-2-il]ossi}fenil)-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
             3-(2,4-dicloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
ossadiazol-2-il]ossi}fenil)-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
        3-(4-cloro-2-fluoro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
ossadiazol-2-il]ossi}fenil)-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
     3-(4-cloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-
il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
- 3-(2,4-dicloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-
2-il] ossifenil) -1-metil-6-(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H)-
pirimidindione;
```

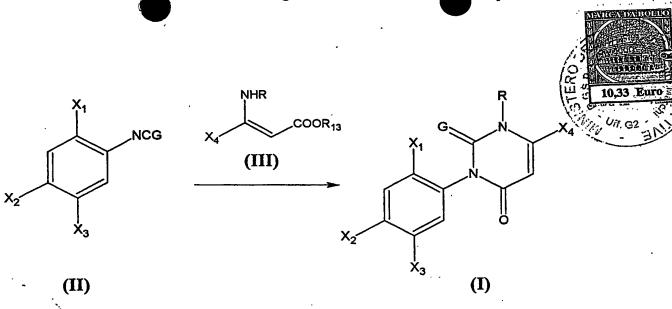
```
3-(4-cloro-2-fluoro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
tiadiazol-2-il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
                3-{4-cloro-3-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-
il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
            3-{2,4-dicloro-3-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-
il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
       3-{4-cloro-2-fluoro-3-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-
il) ossi] fenil} -1-metil-6-(trifluorometil) -2, 4(1H, 3H) -i
pirimidindione;
    3-(4-cloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-ossadiazol-2-
il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-
pirimidindione;
             3-(2,4-dicloro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
ossadiazol-2-il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
        3-(4-cloro-2-fluoro-3-{[5-(trifluorometil)-1,3,4-
ossadiazol-2-il]ossi}fenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-
2,4(1H,3H)-pirimidindione;
               3-{4-cloro-3-[(5-metil-1,3,4-ossadiazol-2-
```

il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-

pirimidindione;

- 3-{2,4-dicloro-3-{(5-metil-1,3,4-ossadiazol-2-il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
- 3-{4-cloro-2-fluoro-3-[(5-metil-1,3,4-ossadiazol-2-il)ossi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindione;
- metil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-metil-6-osso-2-tio-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato;
- metil (2E)-4-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetraidro-3-difluorometil-2,6-diosso-4- (trifluorometil)pirimidin-1-il]fenossi}-3-metossibut-2-enoato.
- 3. Uracili secondo la rivendicazione 1 caratterizzati dal fatto di essere composti di formula (I) isomericamente puri o in miscela isomerica in qualsivoglia proporzione.
 - 4. Procedimento per la preparazione dei composti di formula generale (I) secondo una qualsiasi delle rivendicazioni 1-3, caratterizzato dal prevedere una reazione di ciclocondensazione di un isocianato o isotiocianato di formula generale (II) con un 3-amminocrotonato di formula generale (III) secondo lo schema di reazione 1

Schema 1:



- X_1 , X_2 , X_3 , X_4 , R e G hanno i significati in precedenza definiti;
- R_{13} rappresenta un gruppo alchilico C_1 - C_4 o aloalchilico C_1 - C_4 o un gruppo fenilico eventualmente sostituito da gruppi alchilici C_1 - C_4 .
- 5. Procedimento secondo la rivendicazione 4, caratterizzato dal fatto che la reazione è condotta in presenza di un solvente organico inerte e in presenza di una base organica o preferibilmente inorganica, ad una temperatura compresa tra -20°C e la temperatura di ebollizione della miscela di reazione.
- 6. Procedimento secondo la rivendicazione 4, caratterizzato dal fatto che gli isocianati o isotiocianati di formula generale (II) sono preparati a partire da una anilina sostituita di formula generale (IV) per reazione con un composto di formula generale

(V), quale fosgene, difosgene, trifosgene o tiofosgene, secondo lo schema di reazione 2 Schema 2:

- X_1 , X_2 , X_3 e G hanno i significati in precedenza definiti;
- L₃ e L₄, uguali o diversi tra loro rappresentano un atomo di cloro o un gruppo CCl3O-.
- rivendicazione Procedimento secondo la caratterizzato dal fatto che la reazione è condotta in presenza di un solvente organico inerte, ad una temperatura compresa tra 0°C e la temperatura di ebollizione della miscela stessa, eventualmente presenza di un catalizzatore quale la trietilammina, in quantità variabile tra lo 0.001 e il 100% in peso rispetto all'anilina (IV), con una quantità di reagente (V) variabile tra 1 e 3 moli per mole di anilina (IV).

Procedimento per la preparazione dei composti di generale (I) secondo una qualsiasi delle formula rivendicazioni 1-3, in cui X3 rappresenta un gruppo $Q(CR_1R_2)_nZ$ -, un gruppo Q_1Z -, un gruppo Y(OC)- CR_6 = CR_5 - CR_3R_4Z composti (Ia), caratterizzato dal prevedere reazione di un uracile di formula generale (VI) con un composto di formula generale (VII) secondo lo schema di reazione 3

Schema 3:

$$X_1$$
 X_2
 X_3
 X_4
 X_4
 X_4
 X_1
 X_2
 X_1
 X_2
 X_3
 X_4
 X_4
 X_4
 X_4
 X_4
 X_1
 X_2
 X_2
 X_3
 X_4
 X_4
 X_4
 X_5
 X_6
 X_7
 X_8
 X_8
 X_8
 X_9
 X_9
 X_9
 X_1
 X_1
 X_1
 X_2
 X_1
 X_2
 X_3
 X_4
 X_4
 X_5
 X_8
 X_8
 X_8
 X_8
 X_9
 X_9
 X_1
 X_1
 X_2
 X_1
 X_2
 X_3
 X_4
 X_4
 X_1
 X_2
 X_3
 X_4
 X_4
 X_5
 X_8
 X_8

- X_1 , X_2 , X_4 , G e Z hanno i significati in precedenza definiti;
- R rappresenta un gruppo alchilico C1-C3 o un gruppo aloalchilico C1-C3;
- W rappresenta un gruppo $Q(CR_1R_2)_n$ -, un gruppo Q_1 -, un gruppo $Y(OC)-CR_6=CR_5-CR_3R_4-$, in cui R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , Y, Q e Q₁ hanno i significati precedentemente definiti;

- L_2 rappresenta un atomo di alogeno, un gruppo R_LSO_2O- , in cui R_L rappresenta un gruppo alchilico C_1-C_4 o aloalchilico C_1-C_4 o un gruppo fenilico eventualmente sostituito da gruppi alchilici C_1-C_4 , oppure rappresenta un gruppo $R_{L1}SO_2-$ in cui R_{L1} rappresenta un gruppo alchilico C_1-C_4 o aloalchilico C_1-C_4 .
- 9. Procedimento secondo la rivendicazione 8, caratterizzato dal fatto che la reazione tra i composti di formula generale (VI) ed i composti di formula generale (VII) viene condotta in presenza di uno o più solventi organici inerti ed in presenza di una base, preferibilmente inorganica, ad una temperatura compresa tra -10°C e la temperatura di ebollizione della miscela di reazione.
- 10. Procedimento per la preparazione dei composti di formula generale (I) secondo una qualsiasi delle rivendicazioni 1-3, in cui G = O e R ≠ H, composti (Ic), caratterizzato dal prevedere la reazione di un uracile di formula generale (Ib) con un composto alchilante di formula generale (VIII) secondo lo schema di reazione 4 Schema 4:

- 89 - Ing. Barzanò & Zanardo no S.p.A.

R'-L₁
(VIII)

(Ic)

- X_1 , X_2 , X_3 ed X_4 hanno i significati in precedenza definiti;
- R' rappresenta un gruppo alchilico C_1 - C_3 o un gruppo alcalchilico C_1 - C_3 ;
- L_1 rappresenta un atomo di alogeno, oppure un gruppo R_LSO_2O- in cui R_L rappresenta un gruppo alchilico C_1-C_4 o aloalchilico C_1-C_4 o un gruppo fenilico eventualmente sostituito da gruppi alchilici C_1-C_4 .
- 11. Procedimento secondo la rivendicazione 10, caratterizzato dal fatto che la reazione tra i composti di formula generale (Ib) e i composti di formula generale (VIII) viene condotta in presenza di uno o più solventi organici inerti e in presenza di una base, preferibilmente inorganica, ad una temperatura compresa tra -10°C e la temperatura di ebollizione della miscela di reazione.

- 12. Procedimento secondo la rivendicazione 8 o rivendicazione 10, caratterizzato dal fatto che reazione è condotta in un sistema bifasico utilizzando un solvente organico come solventi l'acqua ed immiscibile con essa, in presenza di catalizzatori di trasferimento di fase.
- 13. Procedimento per la preparazione dei composti di formula generale (I) secondo una qualsiasi delle rivendicazioni 1-3, in cui G = 0, composti (Id), caratterizzato dal prevedere una prima reazione tra una anilina sostituita di formula (IV) e un cloroformiato o un carbonato di formula (IX) a dare un carbammato di formula (X) e una seconda reazione in cui il carbammato è convertito nei composti di formula generale (Id) per ciclocondensazione con un 3-amminocrotonato di formula generale (III), secondo lo schema di reazione 5 Schema 5:

$$X_1$$
 X_1
 X_2
 X_3
 X_4
 X_4
 X_4
 X_4
 X_4
 X_5
 X_4
 X_5
 X_5
 X_5
 X_5
 X_5
 X_5
 X_5
 X_6
 X_7
 X_8
 X_8

- X_1 , X_2 , X_3 , X_4 e R hanno i significati in precedenza definiti;
- L₅ rappresenta un atomo di alogeno od un gruppo OR₁₄
- R_{13} e R_{14} rappresentano un gruppo alchilico C_1 - C_4 o aloalchilico C1-C4 o un gruppo fenilico eventualmente sostituito da gruppi alchilici C1-C4.
- rivendicazione 13, 14. Procedimento secondo la caratterizzato dal fatto che la prima reazione è condotta in presenza di un solvente organico inerte, ad una temperatura compresa tra -10°C e la temperatura di

ebollizione della miscela stessa, in presenza di una base organica od inorganica, in quantità variabile tra 1 e 1.5 moli per mole di anilina (IV), con una quantità di composto di formula (IX) variabile tra 1 e 1.5 moli per mole di anilina (IV).

- secondo la rivendicazione 13, Procedimento caratterizzato dal fatto che la reazione ciclocondensazione del carbammato di formula generale (X) con il 3-amminocrotonato di formula generale (III) è condotta in presenza di un solvente organico inerte e in preferibilmente 0 presenza di una base organica inorganica, ad una temperatura compresa tra -20°C e la temperatura di ebollizione della miscela di reazione.
- 16. Uso degli uracili di formula generale (I) secondo una qualsiasi delle rivendicazioni 1-3 quali erbicidi.
- 17. Uso secondo la rivendicazione 16 per il controllo in pre-emergenza e/o in post-emergenza, di erbe infestanti monocotiledoni e dicotiledoni.
- 18. Metodo per il controllo di erbe infestanti in aree coltivate mediante l'applicazione dei composti aventi formula generale (I) secondo una delle rivendicazioni 1-3.
- 19. Metodo secondo la rivendicazione 18, caratterizzato dal fatto che la quantità di composto di formula (I) da

applicare varia tra Dosi di composto comprese tra 1g e 1000g per ettaro.

- 20. Composizioni erbicide contenenti quale principio attivo uno o più composti aventi formula generale (I) secondo una delle rivendicazioni 1-3, eventualmente anche come miscela di isomeri.
- 21. Composizioni erbicide secondo la rivendicazione 20, comprendenti altri principi attivi compatibili con i composti di formula generale (I), quali altri erbicidi, fungicidi, insetticidi, acaricidi, fertilizzanti, ecc..
- 22. Composizioni erbicide secondo la rivendicazione 21, caratterizzate dal fatto che gli ulteriori erbicidi sono scelti tra:

acetochlor, acifluorfen, aclonifen, AKH-7088, alachlor, alloxydim, ametryn, amicarbazone, amidosulfuron, amitrole, anilofos, asulam, atrazine, azafenidin, azimsulfuron, aziprotryne, BAY MKH 6561, beflubutamid, benfluralin, benfuresate, bensulfuron, benazolin, bensulide, bentazone, benzfendizone, benzobicyclon, benzofenap, benzthiazuron, bifenox, bilanafos, bispyribac-sodium, bromacil, bromobutide, bromofenoxim, butafenacil, butamifos, bromoxynil, butachlor, butralin, butroxydim, butylate, butenachlor, cafenstrole, carbetamide, carfentrazone-ethyl, chlomethoxyfen, chloramben, chlorbromuron, chlorbufam, chlorflurenol, chloridazon, chlorimuron, chlornitrofen, chlorotoluron, chloroxuron, chlorpropham, chlorsulfuron, chlorthal, chlorthiamid, cinidon ethyl, cinmethylin, cinosulfuron, clethodim, clomazone, clodinafop, clomeprop, clopyralid, cloransulam-methyl, cumyluron (JC-940), cyanazine, cycloate, cyclosulfamuron, cycloxydim, cyhalofop-butyl, 2,4-D, 2,4-DB, daimuron, dalapon, desmedipham, desmetryn, dicamba, dichlobenil, dichlorprop, dichlorprop-P, diclofop, diclosulam, diethatyl, difenoxuron, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopyr, dimefuron, dimepiperate, dimethachlor, dimethametryn, dimethenamid, dinitramine, dinoseb, dinoseb acetate, dinoterb, diphenamid, dipropetryn, diquat, dithiopyr, 1-diuron, eglinazine, endothal, EPTC, esprocarb, ethalfluralin, ethametsulfuron-methyl, ethidimuron, ethiozin (SMY 1500), ethofumesate, ethoxyfen-ethyl (HC-252), ethoxysulfuron, etobenzanid 52), fenoxaprop, fenoxaprop-P, fentrazamide, (HW flamprop-M, flazasulfuron, flamprop, fenuron, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazolate (JV 485), flufenacet, flucarbazone-sodium, fluchloralin, flufenpyr ethyl, flumetsulam, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, flumipropin, fluometuron, fluoroglycofen, fluoronitrofen, flupoxam, flupropanate, flupyrsulfuron, flurenol, fluridone, flurochloridone, fluroxypyr, flurtamone, fluthiacet-methyl, fomesafen, foramsulfuron, furyloxyfen, fosamine, glufosinate, glyphosate, halosulfuron-methyl, haloxyfop, haloxyfop-P-methyl, hexazinone, imazamethabenz, imazamox, imazapic, imazaquin, imazethapyr, imazapyr, imazosulfuron, indanofan, iodosulfuron, ioxynil, isopropalin, isouron, isoproturon, isoxaben, isoxachlortole, isoxaflutole, isoxapyrifop, KPP-421, lactofen, lenacil, linuron, LS830556, MCPA, MCPA-thioethyl, MCPB, mecoprop, mecoprop-P, mefenacet, mesosulfuron, mesotrione, metamitron, metazachlor, methabenzthiazuron, methazole, methoprotryne, methyldymron, metobenzuron, metobromuron, metolachlor, S-metolachlor, metosulam, metoxuron, metribuzin, metsulfuron, molinate, monalide, monolinuron, naproanilide, napropamide, naptalam, NC-330, neburon, nicosulfuron, nipyraclofen, norflurazon, orbencarb, oryzalin, oxadiargyl, oxadiazon, oxasulfuron, oxaziclomefone, oxyfluorfen, paraquat, pebulate, pendimethalin, penoxsulam, pentanochlor, pentoxazone, pethoxamid, phenmedipham, picloram, picolinafen, piperophos, pretilachlor, primisulfuron, prodiamine, profluazol, proglinazine, prometon, prometryne, propachlor, propanil, propaquizafop, propazine, propham, propisochlor, propyzamide, prosulfocarb, prosulfuron, pyraclonil, pyraflufen-ethyl, pyrazogyl (HSA-961), pyrazolynate, pyrazosulfuron, pyrazoxyfen, pyribenzoxim, pyributicarb, pyridafol, pyridate, pyriftalid, pyriminobac-methyl, pyrithiobac-sodium, quinclorac, quizalofop, quizalofop-P, rimsulfuron, quinmerac, sethoxydim, siduron, simazine, simetryn, sulcotrione, sulfometuron-methyl, sulfosulfuron, sulfentrazone, tebutam, tebuthiuron, 2,3,6-TBA, TCA-sodium, tepraloxydim, terbacil, terbumeton, terbuthyl-azine, terbutryn, thenylchlor, thiazafluron, thiazopyr, thifensulfuron-methyl, thiobencarb, thidiazimin, tiocarbazil, tioclorim, tralkoxydim, tri-allate, triasulfuron, triaziflam, tribenuron, triclopyr, trietazine, trifloxysulfuron, trifluralin, triflusulfuron-methyl, tritosulfuron, UBI-C4874, vernolate.

Composizioni secondo una qualsiasi delle 23. rivendicazion1 20-22, caratterizzate dal fatto che la concentrazione di sostanza attiva compresa tra 1 e 90%.

Ing. Barzanò & Zanardo Milano S.p.A.

| MANDATARII

(tirma)

(per sè e par gli aliri)

This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

BLACK BORDERS

IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES

FADED TEXT OR DRAWING

BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING

SKEWED/SLANTED IMAGES

COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS

GRAY SCALE DOCUMENTS

LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT

REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

☐ OTHER:

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.